

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003 年 1 月 3 日 (03.01.2003)

PCT

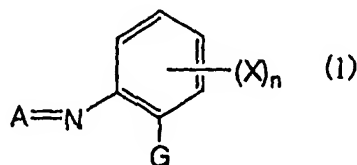
(10) 国際公開番号
WO 03/000659 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07D 213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 277/82, 279/06, 285/16, 285/12, 339/06, 327/04, 411/04, 411/10, 411/14, 413/04, 417/04, 417/10, 417/12, A01N 43/28, 43/30, 43/40, 43/50, 43/52, 43/54, 43/56, 43/64, 43/653, 43/76, 43/78, 43/82, 43/824, 43/824, 43/836, 43/86, 43/88, 43/90
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/06424
- (22) 国際出願日: 2002 年 6 月 26 日 (26.06.2002)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2001-192285 2001 年 6 月 26 日 (26.06.2001) JP
特願2001-193428 2001 年 6 月 26 日 (26.06.2001) JP
特願2001-385120 2001 年 12 月 18 日 (18.12.2001) JP
- 特願2001-386846 2001 年 12 月 20 日 (20.12.2001) JP
特願2002-90213 2002 年 3 月 28 日 (28.03.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 仁木 俊夫 (NIKI, Toshio) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2 番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 水越 隆司 (MIZUKOSHI, Takashi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2 番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 高橋 寛明 (TAKAHASHI, Hiroaki) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町7-2-2 番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 佐藤 純 (SATOW, Jun) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪

[続葉有]

(54) Title: HETEROCYCLOIMINOPHENYL COMPOUNDS AND FUNGICIDES AND INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE

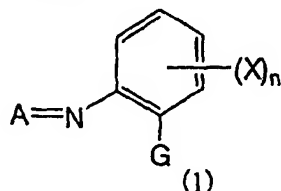
(54) 発明の名称: ヘテロ環イミノフェニル化合物および農園芸用殺菌殺虫剤



(57) Abstract: Heterocycloiminophenyl compounds represented by the general formula (I) or agriculturally acceptable salts thereof; and pesticides, fungicides or insecticides for agricultural and horticultural use, containing the compounds or the salts; wherein A is an optionally substituted heterocycle; X is hydrogen or the like; and G is $-\text{CH}_2\text{COOMe}$, $-\text{N}(\text{Me})\text{COOMe}$, or the like.

(57) 要約:

式 (1) :



〔式中、Aは置換されていてもよいヘテロ環を表し、Xは水素原子等を表し、Gは、 $-\text{CH}_2\text{COOMe}$ 、 $-\text{N}(\text{Me})\text{COOMe}$ 等を表す。〕で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩、それらを含む農薬、農園芸用殺菌剤または農園芸用殺虫剤。



井町 7 2 2 番地 1 日産化学工業株式会社 物質科学
研究所内 Chiba (JP). 小倉 友幸 (OGURA, Tomoyuki)
[JP/JP]; 〒101-0054 東京都 千代田区 神田錦町 3 丁
目 7 番地 1 日産化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 山
岸 和宏 (YAMAGISHI, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒349-0218
埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡 1 4 7 0 日産化
学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 鈴
木 博之 (SUZUKI, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉
県 南埼玉郡 白岡町大字白岡 1 4 7 0 日産化学工業
株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 早坂 史生
(HAYASAKA, Fumio) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉県 南埼
玉郡 白岡町大字白岡 1 4 7 0 日産化学工業株式会
社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

(74) 代理人: 泉名 謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒
101-0042 東京都 千代田区 神田東松下町 3 8 番地 烏
本鋼業ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,

DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM,
PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

明細書

ヘテロ環イミノフェニル化合物および農園芸用殺菌殺虫剤

技術分野

本発明は、新規なヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩、ならびに該ヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤および殺虫剤に関する。

背景技術

ある種のイミノ化合物は、国際特許出願公開公報(WO-95/27693号公報)、ヨーロッパ特許出願公報(EP-254426号公報)で知られていて、農園芸用殺菌剤としての用途が開示されている。

しかし、本発明化合物のヘテロ環イミノフェニル化合物は、文献未記載の新規化合物である。

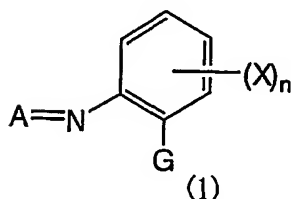
発明の開示

既存の農園芸用殺菌殺虫剤は、耐性菌や抵抗性害虫の増加または既存剤のスペクトラムの狭さ等からその効力や残効性の面で満足するべきものではない。そのため、低薬量で高い効力を有するとともに、より対象作物に対し安全性の高い殺菌剤および殺虫剤の開発が要望されている。

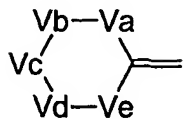
本発明者らは、このような状況に鑑み、優れた殺菌殺虫剤を見いだすべく種々検討した結果、新規なヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩が殺菌剤または殺虫剤として顕著な活性を有し、対象作物に対しても安全であることを見出し、本発明に至った。

すなわち、本発明は、下記の〔1〕ないし〔12〕に関するものである。

〔1〕 式(1)：



〔式中、Aは、



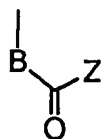
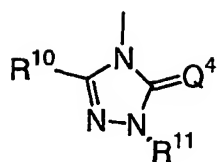
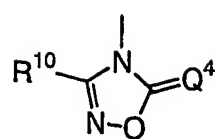
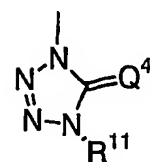
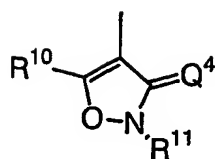
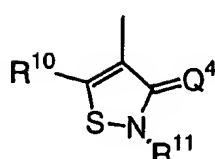
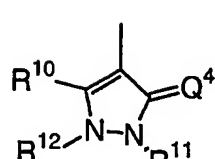
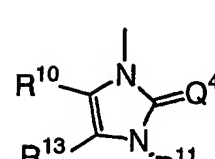
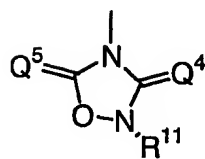
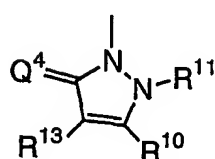
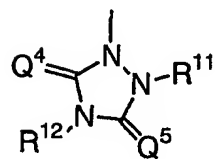
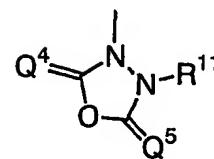
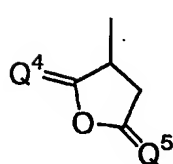
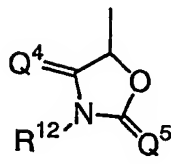
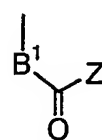
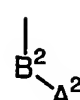
であり、V a、V b、V cおよびV dはそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、V eは炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合であり（但し、V a、V b、V c、V dおよびV eから選ばれる少なくとも1個は、窒素原子、酸素原子または硫黄原子である。） 、

V a - V b、V b - V c、V c - V d、V d - V eの結合は、それぞれ単結合でも2重結合でもよく、

それぞれの原子上に水素原子またはYが結合していてもよく、

ただし、Aがキノロン環を表すときはキノロン環内の窒素原子は、イミノ結合の α 位にあり、イミノ結合がピリミジン環、チアゾリン環またはチアゾリジン環の2位にあるときは、ピリミジン環の一方の窒素原子、チアゾリン環またはチアゾリジン環の窒素原子は置換基Yで置換されており、

Gは、G¹からG¹⁶

G¹:G²:G³:G⁴:G⁵:G⁶:G⁷:G⁸:G⁹:G¹⁰:G¹¹:G¹²:G¹³:G¹⁴:G¹⁵:G¹⁶:

から選ばれる基を表し、

Zは、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ または $-\text{NR}'\text{R}^3$ であり、

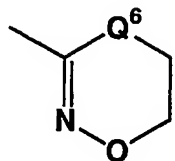
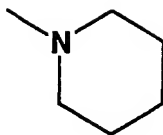
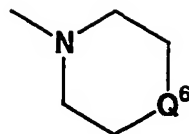
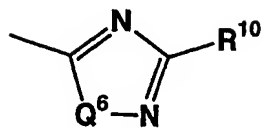
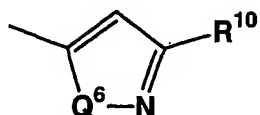
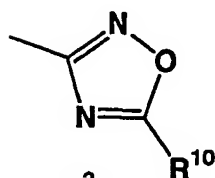
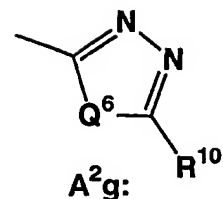
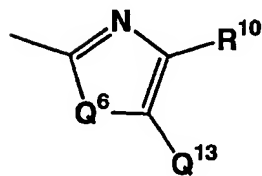
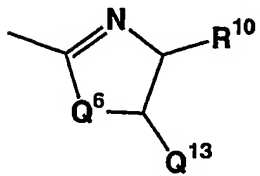
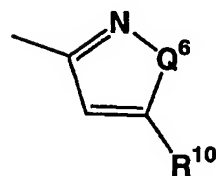
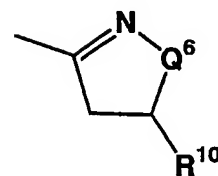
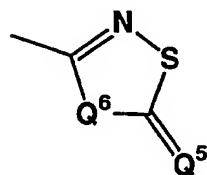
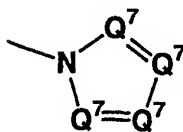
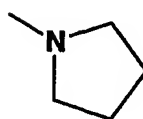
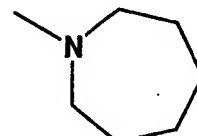
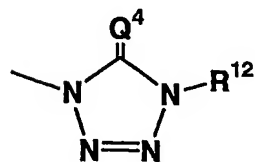
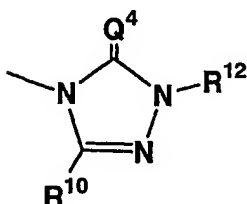
Bは、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ または $-\text{C}(=\text{N}-\text{OR}')$ であり、

B'は、 $-\text{N}(\text{OR}')-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{N}(\text{OR}')-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{OR}')-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{C}$

H-OR') -, -S-C(=CH-OR') -, -N(OR')-C(=N-OR') -, -N(R')-C(=N-OR') -, -O-C(=N-OR') -または-S-C(=N-OR') -であり、

B'は、-CH₂-, -CH(CN)-, -CH(C≡CH)-, -C(=CH-OR') -, -C(=N-OR') -, -CH(OR') -, -N(OR') -, -N(R') -, -O-, -S-, -N(OR')-CH₂-, -N(R')-CH₂-, -O-CH₂-または-S-CH₂-, であり、

A'は、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいピリジルまたはA'aからA'q

**A²a:****A²b:****A²c:****A²d:****A²e:****A²f:****A²g:****A²h:****A²i:****A²j:****A²k:****A²l:****A²m:****A²n:****A²o:****A²p:****A²q:**

から選ばれる基を表し、

Yは、Y' - D - (CH₂)_p - であるか（ただし、Yが2個以上の時は、同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいて

もよい3～7員環または $C=Q'$ を形成するか、あるいは V_a と V_b 、 V_b と V_c 、 V_c と V_d または V_d と V_e 上の2個の置換基 Y どうしが一緒になって、 V_a と V_b 、 V_b と V_c 、 V_c と V_d または V_d と V_e とともに炭素原子、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった1種以上の原子を含み、 Y で置換されていてもよい5または6員環を形成しており、

D は、単結合、 $-NR^5-$ 、 $-C(=Q')-$ 、 $-C(=Q')-C(=Q')-$ 、 $-CR^6=N-$ 、 $-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-N=CR^6-$ 、 $-N=CR^6-O-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-O-CR^6=N-O-$ 、 $-O-N=CR^6-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-NR^5-$ または $-O-N=CR^6-CR^6=N-NR^5-$ であり、

Q' 、 Q'' および Q''' は、各々独立に、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N-R'$ または $=C(R^8)(R^9)$ であり、

Q'' および Q''' は、各々独立に $=O$ または $=S$ であり、

Q'' は、 $-S-$ または $-O-$ であり、

Q''' は、各々独立に、 $=N-$ または $=CH-$ であり、

X は、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ、 $(C_1\sim C_6$ アルキル) $_2$ アミノ、 NO_2 、 CN 、ホルミル、 OH 、 SH 、 NU^1U^1 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 R^4 で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたは $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシであり（ただし、置換する X が、2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい。）、

R^1 、 R^2 および R^3 は、各々独立に、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^4 で置換されていてもよいフェニル $C_1\sim C_6$ アルキルまたは R^4 で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1\sim C_6$ アルキルであり、

R^5 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフェニル C_1

～C₆アルキル、R^{*}で置換されていてもよいフェニル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルまたはR^{*}で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルであり、

R^{*}およびR^{*}は、各々独立に、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルケニルオキシ、C₂～C₆ハロアルケニルオキシ、C₂～C₆アルケニルスルフェニル、C₂～C₆アルケニルスルフィニル、C₂～C₆アルケニルスルホニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルホニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₂～C₆アルキニルオキシ、C₂～C₆ハロアルキニルオキシ、C₂～C₆アルキニルスルフェニル、C₂～C₆アルキニルスルフィニル、C₂～C₆アルキニルスルホニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルフィニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルホニル、NO₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R^{*}で置換されていてもよいフェニル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R^{*}で置換されていてもよいヘテロアリール、R^{*}で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R^{*}で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R^{*}で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R^{*}で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは-NU¹U¹であり、

但し、R^{*}は水素原子であってもよく、

R¹は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロア

ルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーール、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーールオキシ、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーール $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーールスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーールカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリーールオキシカルボニルまたは R^* で置換されていてもよいヘテロアリーール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルであり、

R^8 および R^9 は、各々独立に、水素原子、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 NO_2 、 CN 、ホルミルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^{10} は、水素原子、ハロゲン、 R^{11} 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SOR^{11}$ 、または $-SO_2R^{11}$ であり、

R^{11} は、水素原子、 R^{14} または CN であり、

R^{12} は、水素原子または R^{14} であり、

R^{13} は、水素原子、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキニルであり、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

Y' は、ハロゲン、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルキル、R'で置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルキル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルケニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルキニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロア

リール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 NO_2 、 CN 、ホルミルまたはナフチルであり、

R' は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルホニル、 NO_2 、 CN 、ホルミル、 SH 、 OH 、 SCN 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、フェニルまたは $-NU^1U^2$ であって、置換する R' の数は 1 ないし 5 個であり（ただし、 R' が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

R'' は、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アル

コキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、
 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスル
 フィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$
 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ア
 ルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルフェニ
 ル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$
 ハロアルケニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハ
 ロアルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルオ
 キシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$
 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハ
 ロアルキニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルスルホニル、 NO_2 、 CN 、
 ホルミル、 OH 、 SH 、 SCN 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ
 ルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオ
 キシ、 R' で置換されていてもよいフェニル、 R' で置換されていてもよいフェノ
 キシ、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R' で置換されて
 いてもよいフェニルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ ア
 ルキルスルホニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール、 R' で置換され
 てもよいヘテロアリールオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリー
 ルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R' で置換され
 てもよいフェノキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$
 C_6 アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル
 、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたは R' で置換
 されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $-NU'U'$ で
 あるか、あるいは、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個
 のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であって、置換する R' の数は 1
 ないし 8 個であり（ただし、 R' が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよ
 い）、

R' は、ハロゲン、 R' で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R' で置換さ
 れていてもよい $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R' で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{12}$ ア

ルケニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₁アルキニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₁アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、NO₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されて

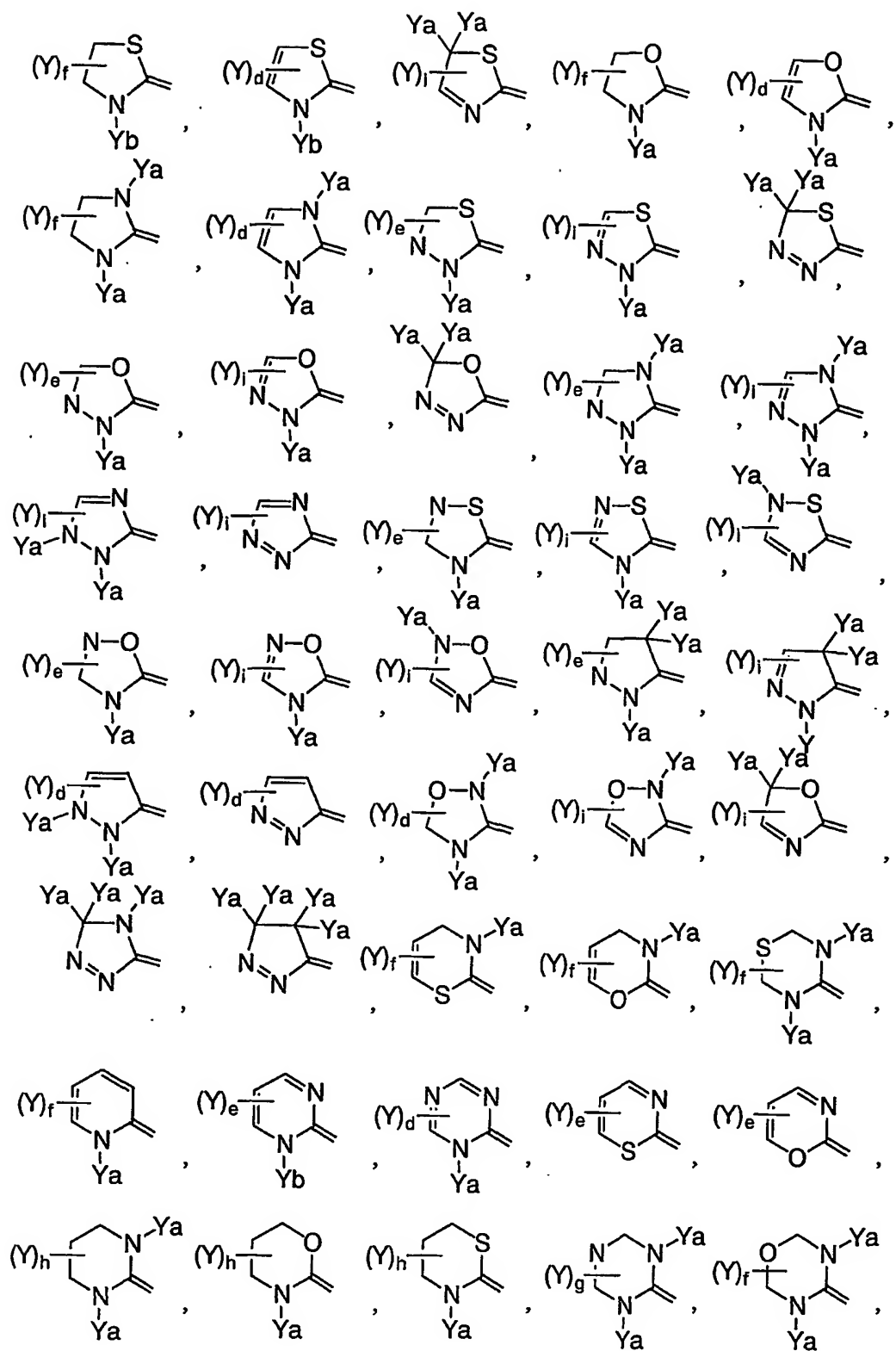
もよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシまたは $-N U' U''$ であり、置換する R' の数は 1 ないし 5 個であり（ただし、 R' が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

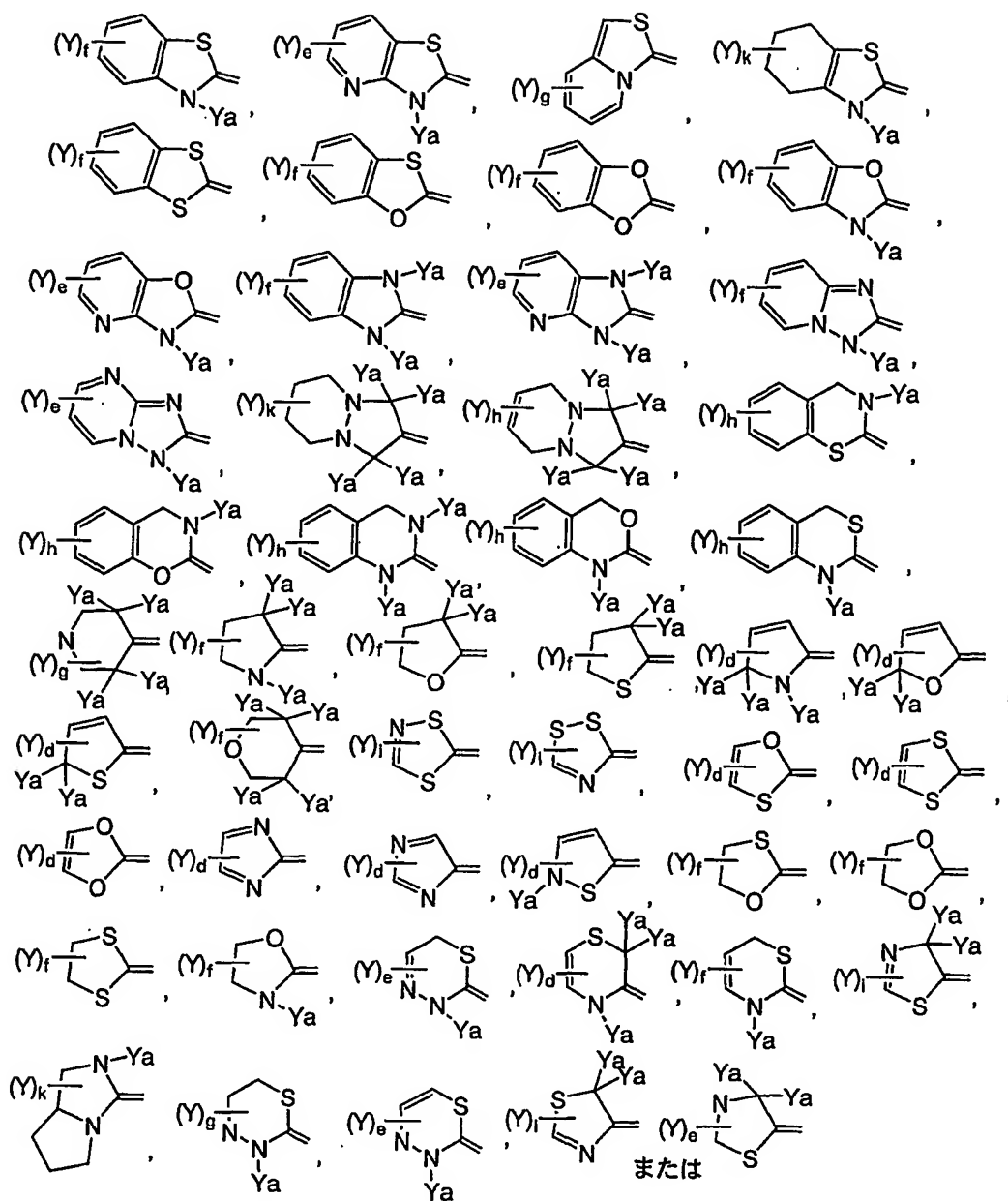
U' および U'' は、各々独立に、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルであるか、あるいは U' および U'' が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であり、

n は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

p は、繰り返しの数を表し、0 から 2 である。} で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

{ 2 } A が





であり、 d は、置換基の数を表し、 0 から 2 であり、

e は、置換基の数を表し、0 から 3 であり、

f は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

g は、置換基の数を表し、0 から 5 であり、

h は、置換基の数を表し、0 から 6 であり、

i は、置換基の数を表し、0 から 1 であり、

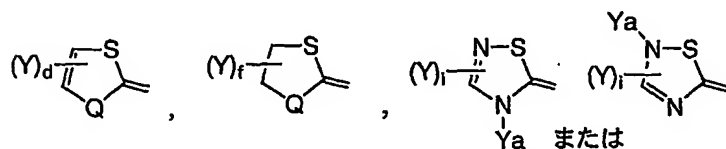
j は、置換基の数を表し、0 から 7 であり、

k は、置換基の数を表し、0 から 8 であり、

Y a、Y b および Y は、互いに独立に $Y' - D - (CH_2)_p$ であるか（ただし、Y または Y a が 2 個以上の時は、Y a どうしまたは Y どうしは互いに同一または異なってもよい。）、A の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y または Y a により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々 1 ～ 3 個含んでいてもよい 3 ～ 7 員環または $C=Q'$ を形成し、

Y は更に水素原子を表していてもよい、〔1〕記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔3〕 A が



を表し、Q は酸素原子、硫黄原子または $N-Y b$ を表し、Y、Y a、Y b、d、f および i は〔2〕と同じ意味を表す、〔1〕または〔2〕記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔4〕 D が単結合であり、p が 0 である〔1〕から〔3〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔5〕 Y' がハロゲン、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルコキシ、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルフェニル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルフィニル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルホニル、R^c で置換されていてもよいフェニルまたは R^c で置換されていてもよいヘテロアリールである、

〔1〕から〔4〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔6〕 G が G¹、G²、G¹⁶ または $-B^2-A^2a$ である〔1〕から〔5〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔 7 〕 G が $-N(OR')-C(=O)Z$ または $-N(R')-C(=O)Z$ である〔 1 〕から〔 5 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔 8 〕 Y' が少なくともひとつの R' で置換されたフェニルまたは少なくともひとつの R' で置換されたヘテロアリールであり、 R' のうち少なくともひとつがトリフルオロメチルであり、ただし、G が G' のときは n が 1 以上である、〔 1 〕から〔 7 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔 9 〕 農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシュウ酸塩である、〔 1 〕から〔 8 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物の塩。

〔 10 〕 〔 1 〕から〔 9 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

〔 11 〕 〔 1 〕から〔 9 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

〔 12 〕 〔 1 〕から〔 9 〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺虫剤。

ただし、本化合物に、立体異性体、幾何異性体、互変異性体、ジアステレオマーが存在する場合には、それぞれの異性体並びにそれらの混合物の全てを包含する。

発明を実施するための最良の形態

式（ 1 ）で表される本発明化合物の各置換基を、以下に例示する。

なお、略号はそれぞれ以下の意味を示す。

Me はメチル基を、Et はエチル基を、Pr はプロピル基を、Bu はブチル基を、Pen はペンチル基を、Hex はヘキシル基を、Hep はヘプチル基を、Oct はオクチル基を、Non はノニル基を、Dec はデシル基を、Undec はウンデシル基を、Dodec はドデシ

ル基を、nはノーマルを、iはイソを、sはセカンダリーを、tはターシャリーを、cはシクロをそれぞれ表し、Phはフェニル基を表し、フェニル基の表記において例えば2-Cl-Phは2-クロロフェニル基を表し、2-MeO-3-Me-Phは2-メトキシ-3-メチルフェニル基を表す。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^a 、X、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチルおよび4-メチルペンチル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{13} 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、XおよびY' の定義におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^a 、X、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルとしてフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-i-プロピル、1-クロロ-i-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロ-n-プロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フルオロペンチル、6-クロロヘキシルおよび6-フルオロヘキシル等があげられる。

。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^a 、 R^b 、 U^1 および U^2 の定義における $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^a 、 R^b および X の定義における $C_1 \sim C_6$ アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、 n -プロポキシ、 i -プロポキシ、 n -ブトキシ、 i -ブトキシ、 s -ブトキシ、 t -ブトキシ、 n -ペンチルオキシ、 n -ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシおよび4-メチルペンチルオキシ等があげられる。

。

R^5 、 R^6 、 R^a 、 R^b および X の定義における $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシとしては、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖状または分岐状のハロアルコキシがあげられ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-プロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-プロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-プロモプロポキシ、1-フルオロ- i -プロポキシ、1-クロロ- i -プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、

6-クロロヘキシルオキシおよび6-フルオロヘキシルオキシ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} およびXの定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフェニルとしてメチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、*i*-プロピルチオ、*n*-ブチルチオ、*i*-ブチルチオ、*s*-ブチルチオ、*t*-ブチルチオ、*n*-ペンチルチオおよび*n*-ヘキシルチオ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^{10} および R^{11} の定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフィニルとしてメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、*n*-プロピルスルフィニル、*i*-プロピルスルフィニル、*n*-ブチルスルフィニル、*i*-ブチルスルフィニル、*s*-ブチルスルフィニル、*t*-ブチルスルフィニル、*n*-ペンチルスルフィニルおよび*n*-ヘキシルスルフィニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{11} 、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルホニルとしてメチルスルホニル、エチルスルホニル、*n*-プロピルスルホニル、*i*-プロピルスルホニル、*n*-ブチルスルホニル、*i*-ブチルスルホニル、*s*-ブチルスルホニル、*t*-ブチルスルホニル、*n*-ペンチルスルホニルおよび*n*-ヘキシルスルホニル等があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{13} 、 R^{14} 、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、メトキシメチル、エトキシメチル、*n*-プロポキシメチル、*i*-プロポキシメチル、*n*-ブトキシメチル、*i*-ブトキシメチル、*s*-ブトキシメチル、*t*-ブトキシメチル、*n*-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピルおよび3-メトキシプロピル等があげられる。

R^{14} の定義における $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシとしては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、*n*-プロポキシメトキシ、*i*-プロポキシメトキシ、*n*-ブトキシメトキシ、*i*-ブトキシメトキシ、*s*-ブトキシメトキシ、*t*-ブトキシメトキシ、*n*-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシおよび3-メトキシプロポキシ等があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 U^1 および U^2 の定義における C_1

～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖状または分岐状のアルキルスルフェニルアルキルとして、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピルおよび3-メチルチオプロピル等があげられる。

R^bの定義におけるC₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、メチルチオメトキシ、エチルチオメトキシ、n-プロピルチオメトキシ、i-プロピルチオメトキシ、n-ブチルチオメトキシ、i-ブチルチオメトキシ、s-ブチルチオメトキシ、t-ブチルチオメトキシ、n-ペンチルチオメトキシ、2-メチルチオエトキシ、3-エチルチオプロボキシおよび3-メチルチオプロボキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルフェニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルチオとしてフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオおよび1-フルオロ-i-プロピルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルフィニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルスルフィニルとしてフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、ブロモジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニルおよび1-フルオロ-i-プロピルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^a、R^b、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルホニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルスルホニルとしてフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ブロモジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル等があげられる。

ニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニルおよび1-フルオロ-*i*-プロピルスルホニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁸、R⁹、R¹³、R¹⁴およびR^aの定義におけるC₂~C₆アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニルおよび1-エチル-1-メチル-2-プロペニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R¹⁴およびR^aの定義におけるC₂~C₆ハロアルケニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルとして2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂~C₆アルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルケニルオキシとして1-メチルエテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-メチル-2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオ

キシおよび2-メチル-2-プロペニルオキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^a、R^bおよびXおよびの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルオキシとして2-クロロエテニルオキシ、2-ブロモエテニルオキシ、2,2-ジクロロエテニルオキシ、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3-フルオロ-2-プロペニルオキシ、3-ブロモ-2-プロペニルオキシ、3-ヨード-2-プロペニルオキシ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルオキシおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフェニルとして1-メチルエテニルチオ、2-プロペニルチオ、1-メチル-2-プロペニルチオ、2-ブテニルチオ、3-ブテニルチオおよび2-メチル-2-プロペニルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフィニルとして1-メチルエテニルスルフィニル、2-プロペニルスルフィニル、1-メチル-2-プロペニルスルフィニル、2-ブテニルスルフィニル、3-ブテニルスルフィニルおよび2-メチル-2-プロペニルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルホニルとして1-メチルエテニルスルホニル、2-プロペニルスルホニル、1-メチル-2-プロペニルスルホニル、2-ブテニルスルホニル、3-ブテニルスルホニルおよび2-メチル-2-プロペニルスルホニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフェニルとして2-クロロエテニルチオ、2-ブロモエテニルチオ、2,2-ジクロロエテニルチオ、3-クロロ-2-プロペニルチオ、3-フルオロ-2-プロペニルチオ、3-ブロモ-2-プロペニルチオ、3-ヨード-2-プロペニルチオ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルチオ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルチオ、4-クロロ-2-ブテニルチオ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルチオおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルチオ等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフィニルとして2-クロロエテニルスルフィニル、2-ブロモエテニルスルフィニル、2,2-ジクロロエテニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロペニルスルフィニル、3-フルオロ-2-プロペニルスルフィニル、3-ブロモ-2-プロペニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルフィニル、4-クロロ-2-ブテニルスルフィニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルスルフィニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルスルフィニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルホニルとして2-クロロエテニルスルホニル、2-ブロモエテニルスルホニル、2,2-ジクロロエテニルスルホニル、3-クロロ-2-プロペニルスルホニル、3-フルオロ-2-プロペニルスルホニル、3-ブロモ-2-プロペニルスルホニル、3-ヨード-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルホニル、4-クロロ-2-ブテニルスルホニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルスルホニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルスルホニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R¹³、R¹⁴およびR^aの定義におけるC₂～C₆アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニルおよびヘキシニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R¹⁴およびR^aの定義におけるC₂～C₆ハロアルキニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルとしてクロロエチニル、ブロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-

プロピニル、4-ブロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂~C₆アルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキニルオキシとしてエチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ、1,1-ジメチル-2-プロピニルオキシ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ、1-メチル-2-ブチニルオキシ、1,1-ジメチル-2-ブチニルオキシ、1-ペンチニルオキシ、2-ペンチニルオキシ、3-ペンチニルオキシ、4-ペンチニルオキシおよびヘキシニルオキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂~C₆ハロアルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルオキシとしてクロロエチニルオキシ、ブロモエチニルオキシ、ヨードエチニルオキシ、3-クロロ-2-プロピニルオキシ、3-ブロモ-2-プロピニルオキシ、3-ヨード-2-プロピニルオキシ、4-ブロモ-3-ブチニルオキシ、4-ヨード-3-ブチニルオキシおよび6-ヨード-5-ヘキシニルオキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂~C₆アルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフェニルとしてエチニルチオ、2-プロピニルチオ、1-メチル-2-プロピニルチオ、1,1-ジメチル-2-プロピニルチオ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルチオ、2-ブチニルチオ、3-ブチニルチオ、1-メチル-2-ブチニルチオ、1,1-ジメチル-2-ブチニルチオ、1-ペンチニルチオ、2-ペンチニルチオ、3-ペンチニルチオ、4-ペンチニルチオおよびヘキシニルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂~C₆アルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフィニルとしてエチニルスルフィニル、2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-2-プロピニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルフィニル、2-ブチニルスルフィニル、3-ブチニルスルフィニル、1-メチル-2-ブチニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルフィニル、1-ペンチニルスルフィニル、2-ペンチニルスルフィニル、3-ペンチニルスルフィニル、4-ペンチニルス

ルフィニルおよびヘキシニルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルホニルとしてエチニルスルホニル、2-プロピニルスルホニル、1-メチル-2-プロピニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルホニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルホニル、2-ブチニルスルホニル、3-ブチニルスルホニル、1-メチル-2-ブチニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルホニル、1-ペンチニルスルホニル、2-ペンチニルスルホニル、3-ペンチニルスルホニル、4-ペンチニルスルホニルおよびヘキシニルスルホニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフェニルとしてクロロエチニルチオ、ブromoエチニルチオ、ヨードエチニルチオ、3-クロロ-2-プロピニルチオ、3-ブromo-2-プロピニルチオ、3-ヨード-2-プロピニルチオ、4-ブromo-3-ブチニルチオ、4-ヨード-3-ブチニルチオおよび6-ヨード-5-ヘキシニルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフィニルとしてクロロエチニルスルフィニル、ブromoエチニルスルフィニル、ヨードエチニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロピニルスルフィニル、3-ブromo-2-プロピニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロピニルスルフィニル、4-ブromo-3-ブチニルスルフィニル、4-ヨード-3-ブチニルスルフィニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルホニルとしてクロロエチニルスルホニル、ブromoエチニルスルホニル、ヨードエチニルスルホニル、3-クロロ-2-プロピニルスルホニル、3-ブromo-2-プロピニルスルホニル、3-ヨード-2-プロピニルスルホニル、4-ブromo-3-ブチニルスルホニル、4-ヨード-3-ブチニルスルホニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニルスルホニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^a、R⁹、R¹⁴、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁

～C₆アルコキシカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルコキシカルボニルとしてメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニルおよびn-ヘキシルオキシカルボニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R¹⁴、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆アルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルとしてアセチル、プロピオニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、i-ブチルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、n-ペンチルカルボニルおよびn-ヘキシルカルボニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆のハロアルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルカルボニルとしてクロロアセチル、フルオロアセチル、クロロフルオロアセチル、クロロジフルオロアセチル、ジクロロアセチル、ジフルオロアセチル、トリフルオロアセチル、3,3,3-トリフルオロプロピオニルおよびペンタフルオロプロピオニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆アルキルカルボニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルオキシとしてアセチルオキシ、プロピオニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、s-ブチルカルボニルオキシ、t-ブチルカルボニルオキシ、n-ペンチルカルボニルオキシおよびn-ヘキシルカルボニルオキシ等があげられる。

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR^cの定義における、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルブ

ロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^c の定義における R^a で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^b および R^c の定義における R^a で置換されていてもよいフェニルとしては、Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph、4-Br-Ph、2,4-Cl₂-Ph、3,4-Cl₂-Ph、2,4,6-Cl₃-Ph、3,4-(MeO)₂-Ph、2-Cl-4-Me-Ph、2-MeO-4-Me-Ph、2-Cl-4-i-PrO-Ph、3-Cl-4-PhCH₂O-Ph、2,4-Me₂-Ph、2,5-Me₂-Ph、2,6-F₂-Ph、2,3,4,5,6-F₅-Ph、4-Et-Ph、4-i-Pr-Ph、4-n-Bu-Ph、4-s-Bu-Ph、4-t-Bu-Ph、4-(t-BuCH₂)-Ph、4-Et(Me)₂C-Ph、4-n-Hex-Ph、4-((Me)₂(CN)C)-Ph、4-(MeCH=CH)-Ph、4-(MeC≡C)-Ph、4-CF₃-Ph、4-CF₃CH₂-Ph、4-(Cl₂C=CHCH₂)-Ph、4-(BrC

$\equiv \text{C}$)-Ph, 4-(2,2-F₂-c-BuCH₂)-Ph, 4-(1-Me-c-Pr)-Ph, 4-i-PrO-Ph, 4-t-BuO-Ph,
 4-n-HexO-Ph, 4-MeCC(O)Ph, 4-(CH₂=CHCH₂O)-Ph, 4-CHF₂O-Ph, 4-CBrF₂O-Ph,
 4-CF₃O-Ph, 4-CF₃CH₂O-Ph, 4-(CF₂=CHCH₂CH₂O)-Ph, 4-CCl₃CCH₂O-Ph, 4-MeS-Ph,
 4-s-BuS-Ph, 4-EtSO-Ph, 4-MeSO₂-Ph, 4-EtSO₂-Ph, 4-i-PrSO₂-Ph, 4-t-BuSO₂-Ph,
 4-(MeCH=CHCH₂S)-Ph, 4-(CH₂=CHCH₂SO)-Ph, 4-(ClCH=CHCH₂SO₂)-Ph, 4-(HC \equiv CCH₂S)-Ph,
 4-(HC \equiv CCH₂SO-Ph), 4-(HC \equiv CCH₂SO₂)-Ph, 4-CHF₂S-Ph, 4-CBrF₂S-Ph,
 4-CF₃S-Ph, 4-CF₃CH₂S-Ph, 4-CHF₂CF₂S-Ph, 4-CHF₂SO-Ph, 4-CBrF₂SO-Ph,
 4-CF₃SO-Ph, 4-CF₃CH₂SO₂-Ph, 4-CHF₂CF₂SO₂-Ph, 4-CHF₂SO₂-Ph, 4-CBrF₂SO₂-Ph,
 4-CF₃SO₂-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂S)-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO)-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO₂)-Ph,
 4-(BrC \equiv CCH₂S)-Ph, 4-(BrC \equiv CCH₂SO)-Ph, 4-(BrC \equiv CCH₂SO₂)-Ph, 4-CHO-Ph,
 4-NO₂-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph, 4-(Me)₂N-Ph, 4-Me(MeC(O))N-Ph, 4-PhN(Me)-Ph,
 4-PhCH₂(MeC(O))N-Ph, 4-MeC(O)-Ph, 4-EtC(O)-Ph, 4-n-PrC(O)-Ph, 4-i-PrC(O)-Ph,
 4-i-BuC(O)-Ph, 4-t-BuC(O)-Ph, 4-i-BuCH₂C(O)-Ph, 4-Et(Me)₂CC(O)-Ph,
 4-n-HexC(O)-Ph, 4-MeOCH₂-Ph, 4-EtOCH₂-Ph, 4-i-PrOCH₂-Ph, 4-MeSCH₂-Ph,
 4-EtSCH₂-Ph, 4-i-PrSCH₂-Ph, 4-CF₃C(O)-Ph, 4-CF₃CF₂C(O)-Ph, 4-MeC(O)O-Ph,
 4-EtC(O)O-Ph, 4-n-PrC(O)O-Ph, 4-i-PrC(O)O-Ph, 4-i-BuC(O)O-Ph, 4-t-BuC(O)O-Ph,
 4-i-BuCH₂C(O)O-Ph, 4-Et(Me)₂CC(O)O-Ph, 4-n-HexC(O)O-Ph, 4-CF₃C(O)O-Ph,
 4-CF₃CF₂C(O)O-Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2,3-Cl₂-Ph,
 2,3-F₂-Ph, 2,5-F₂-Ph, 3,4-F₂-Ph, 3,5-F₂-Ph, 2,4-F₂-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-(3-Cl-PhCH₂O)-Ph,
 2-F-6-CF₃-Ph, 2-F-6-Cl-Ph, 2-F-6-Me-Ph, 2-F-6-MeO-Ph, 2-F-6-OH-Ph, 2-F-6-MeS-Ph,
 2-F-5-Cl-Ph, 2-F-5-CF₃-Ph, 2-F-5-Me-Ph, 2-F-5-MeO-Ph, 2-F-5-OH-Ph, 2-F-5-MeS-Ph,
 2-F-4-Cl-Ph, 2-F-4-CF₃-Ph, 2-F-4-Me-Ph, 2-F-4-MeO-Ph, 2-F-3-Cl-Ph, 2-F-3-Me-Ph,
 2-F-3-MeO-Ph, 3-F-2-Cl-Ph, 3-F-2-Me-Ph, 3-F-2-MeO-Ph, 3-F-4-Cl-Ph, 3-F-4-Me-Ph,
 3-F-4-MeO-Ph, 3-F-5-Cl-Ph, 3-F-5-Me-Ph, 3-F-5-MeO-Ph, 3-F-6-Cl-Ph, 3-F-6-Me-Ph, 3-F-6-MeO-Ph,
 4-F-2-Cl-Ph, 4-F-2-Me-Ph, 4-F-2-MeO-Ph, 4-F-3-Cl-Ph, 4-F-3-Me-Ph, 4-F-3-MeO-Ph,
 2,4,6-F₃-Ph, 2-OH-Ph, 4-I-Ph, 4-MeOC(O)-Ph, 4-MeNHC(O)-Ph, 2,6-Me₂-Ph,
 3-CF₃-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 2-MeC(O)-Ph, 2-I-Ph, 3-I-Ph, 4-c-Pr-Ph,
 4-(2-Cl-c-Pr)-Ph, 4-(2,2-Cl₂-c-Pr)-Ph, 4-(Ph-CH=CH)-Ph, 4-(Ph-C \equiv C)-P

h, 4-PhS-Ph, 4-HO-Ph, 4-EtO-Ph, 4-PenO-Ph, 2-F-3-CF₃-Ph, 2,3-Me₂-Ph, 3,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,3-(MeO)₂-Ph, 2,4-(MeO)₂-Ph, 2,5-(MeO)₂-Ph, 3,5-(MeO)₂-Ph, 2-F-3-I-Ph, 2-F-4-I-Ph, 2-F-5-I-Ph, 2-F-6-I-Ph, 2-F-4-EtO-Ph, 2-F-4-PrO-Ph, 2-F-4-i-PrO-Ph, 2-F-4-BuO-Ph, 2-F-4-s-BuO-Ph, 2-F-4-i-BuO-Ph, 2-F-4-t-BuO-Ph, 2-F-4-PenO-Ph, 2-F-4-(2-Me-BuO)-Ph, 2-F-4-(2,2-Me₂-PrO)-Ph, 2-F-4-HexO-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph, 2-F-4-Et-Ph, 2-F-4-Pr-Ph, 2-F-4-i-Pr-Ph, 2-F-4-Bu-Ph, 2-F-4-s-Bu-Ph, 2-F-4-i-Bu-Ph, 2-F-4-t-Bu-Ph, 2-F-4-Pen-Ph, 2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph, 2-F-4-(2,2-Me₂-Pr)-Ph, 2-F-4-Hex-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph, 2-F-6-PhS-Ph, 2-F-6-Me₂N-Ph, 2-F-6-MeNH-Ph, 2-F-6-Ph-Ph, 3,4-methylenedioxy-Ph, 3,4-ethylenedioxy-Ph, 2-F-3-Br-Ph, 2-F-4-Br-Ph, 2-F-5-Br-Ph, 2-F-6-Br-Ph, 3-F-2-Br-Ph, 3-F-4-Br-Ph, 3-F-5-Br-Ph, 3-F-6-Br-Ph, 4-F-2-Br-Ph, 4-F-3-Br-Ph, 2-Cl-3-Me-Ph, 2-Cl-4-Me-Ph, 2-Cl-5-Me-Ph, 2-Cl-6-Me-Ph, 3-Cl-2-Me-Ph, 3-Cl-4-Me-Ph, 3-Cl-5-Me-Ph, 3-Cl-6-Me-Ph, 4-Cl-2-Me-Ph, 4-Cl-3-Me-Ph, 2,3-F₂-4-Me-Ph, 2,3-F₂-5-Me-Ph, 2,3-F₂-6-Me-Ph, 2,4-F₂-3-Me-Ph, 2,4-F₂-5-Me-Ph, 2,4-F₂-6-Me-Ph, 2,5-F₂-3-Me-Ph, 2,5-F₂-4-Me-Ph, 2,5-F₂-6-Me-Ph, 2,6-F₂-3-Me-Ph, 2,6-F₂-4-Me-Ph, 2,3-F₂-4-Cl-Ph, 2,3-F₂-5-Cl-Ph, 2,3-F₂-6-Cl-Ph, 2,4-F₂-3-Cl-Ph, 2,4-F₂-5-Cl-Ph, 2,4-F₂-6-Cl-Ph, 2,5-F₂-3-Cl-Ph, 2,5-F₂-4-Cl-Ph, 2,5-F₂-6-Cl-Ph, 2,6-F₂-3-Cl-Ph, 2,6-F₂-4-Cl-Ph, 2,3-F₂-4-MeO-Ph, 2,3-F₂-5-MeO-Ph, 2,3-F₂-6-MeO-Ph, 2,4-F₂-3-MeO-Ph, 2,4-F₂-5-MeO-Ph, 2,4-F₂-6-MeO-Ph, 2,5-F₂-3-MeO-Ph, 2,5-F₂-4-MeO-Ph, 2,5-F₂-6-MeO-Ph, 2,6-F₂-3-MeO-Ph, 2,6-F₂-4-MeO-Ph, 2,3-F₂-4-EtO-Ph, 2,3-F₂-5-EtO-Ph, 2,3-F₂-6-EtO-Ph, 2,4-F₂-3-EtO-Ph, 2,4-F₂-5-EtO-Ph, 2,4-F₂-6-EtO-Ph, 2,5-F₂-3-EtO-Ph, 2,5-F₂-4-EtO-Ph, 2,5-F₂-6-EtO-Ph, 2,6-F₂-3-EtO-Ph, 2,6-F₂-4-EtO-Ph, 2,3-F₂-4-Et-Ph, 2,3-F₂-5-Et-Ph, 2,3-F₂-6-Et-Ph, 2,4-F₂-3-Et-Ph, 2,4-F₂-5-Et-Ph, 2,4-F₂-6-Et-Ph, 2,5-F₂-3-Et-Ph, 2,5-F₂-4-Et-Ph, 2,5-F₂-6-Et-Ph, 2,6-F₂-3-Et-Ph, 2,6-F₂-4-Et-Ph, 2,3-F₂-4-Br-Ph, 2,3-F₂-5-Br-Ph, 2,3-F₂-6-Br-Ph, 2,4-F₂-3-Br-Ph, 2,4-F₂-5-Br-Ph, 2,4-F₂-6-Br-Ph, 2,5-F₂-3-Br-Ph, 2,5-F₂-4-Br-Ph, 2,5-F₂-6-Br-Ph, 2,6-F₂-3-Br-Ph, 2,6-F₂-4-Br-Ph, 2,6-F₂-4-Pr-Ph, 2,6-F₂-4-i-Pr-Ph, 2,6-F₂-4-

c-Pr-Ph、2,6-F₂-4-Bu-Ph、2,6-F₂-4-i-Bu-Ph、2,6-F₂-4-s-Bu-Ph、2,6-F₂-4-t-Bu-Ph、2,6-F₂-4-Pen-Ph、2,6-F₂-4-Hex-Ph、2,6-F₂-4-Ph-Ph、2,6-F₂-4-PhCH₂-Ph、2,6-F₂-4-PrO-Ph、2,6-F₂-4-i-PrO-Ph、2,6-F₂-4-c-PrO-Ph、2,6-F₂-4-BuO-Ph、2,6-F₂-4-i-BuO-Ph、2,6-F₂-4-s-BuO-Ph、2,6-F₂-4-t-BuO-Ph、2,6-F₂-4-PenO-Ph、2,6-F₂-4-HexO-Ph、2,6-F₂-4-PhO-Ph、2,6-F₂-4-PhCH₂O-Ph、2-F-6-Cl-3-MeO-Ph、2-F-6-Cl-4-MeO-Ph、2-F-6-Cl-5-MeO-Ph、2-F-6-Cl-3-Me-Ph、2-F-6-Cl-4-Me-Ph、2-F-6-Cl-5-Me-Ph、2-F-6-MeO-3-Cl-Ph、2-F-6-MeO-4-Cl-Ph、2-F-6-MeO-5-Cl-Ph、2-F-6-MeO-3-Me-Ph、2-F-6-MeO-4-Me-Ph、2-F-6-MeO-5-Me-Ph、2,4,6-Me₃-Ph、2-Cl-3-MeO-Ph、2-Cl-4-MeO-Ph、2-Cl-5-MeO-Ph、2-Cl-6-MeO-Ph、3-Cl-2-MeO-Ph、3-Cl-4-MeO-Ph、3-Cl-5-MeO-Ph、3-Cl-6-MeO-Ph、4-Cl-2-MeO-Ph、4-Cl-3-MeO-Ph、2-Me-3-MeO-Ph、2-Me-4-MeO-Ph、2-Me-5-MeO-Ph、2-Me-6-MeO-Ph、3-Me-2-MeO-Ph、3-Me-4-MeO-Ph、3-Me-5-MeO-Ph、3-Me-6-MeO-Ph、4-Me-3-MeO-Phおよび2,6-(MeO)₂-Ph等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^bおよびR^cにおける、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールとしては、5-クロロチオフェン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブromo-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^b、R^cおよびXにおける、R^aで置換されていてもよいフェ

ニルスルホニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-プロモフェニル、3-プロモフェニル、4-プロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

R^b、R^c、R^d、R^eおよびR^fにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルとしては、ベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-イソブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニル

ヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

R⁷、R⁸およびR⁹における、R^aで置換されていてもよいフェノキシおよびR^aで置換されていてもよいフェノキシカルボニルにより定義される、R^aで置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロフェノキシ、2-ブロモフェノキシ、3-ブロモフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

R⁷、R⁸およびR⁹の定義における、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-*t*-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチ

ル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

R⁷、R⁸およびR⁹における、R⁸で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシおよびR⁹で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシカルボニルで定義される、R⁸で置換されていてもよいヘテロアリアルオキシとしては、5-クロロチオフエン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-ピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3-トリアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2-

-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

R^aにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルスルフィニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

R^aにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルカルボニルオキシで定義されるR^aで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-*t*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル

、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

R^aにおける、R^aで置換されていてもよいヘテロアリーールスルフィニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリーールスルフェニルおよびR^aで置換されていてもよいヘテロアリーールカルボニルオキシで定義されるR^aで置換されていてもよいヘテロアリーールとしては、5-クロロチオフエン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

R^aの定義におけるR^aで置換されていてもよいヘテロアリーールC₁~C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリーールアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフエン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミ

ジン-2-イル) ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル) ペンチルオキシおよび6-(ピロール-1-イル) ヘキシルオキシ等が挙げられる。

R[°]における、R[°]で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフェニル、R[°]で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフィニル、R[°]で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルホニル、R[°]で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルカルボニルオキシで定義される、R[°]で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル) エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピル、4-(ピリジン-2-イル) ブチル、5-(トリアゾール-1-イル) ペンチルおよび6-(ピロール-1-イル) ヘキシル等が挙げられる。

Y' における、R[°]で置換されていてもよいフェニル、R[°]で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R[°]で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R[°]で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R[°]で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよびR[°]で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義されるR[°]で置換されていてもよいフェニルとしては、Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph、4-Br-Ph、2,4-Cl₂-Ph、3,4-Cl₂-Ph、2,4,6-Cl₃-Ph、3,4-(MeO)₂-Ph、2-Cl-4-Me-Ph、2-MeO-4-Me-Ph、2-Cl-4-i-PrO-Ph、3-Cl-4-PhCH₂O-Ph、2,4-Me₂-Ph、2,5-Me₂-Ph、2,6-F₂-Ph、2,3,4,5,6-F₅-Ph、4-Et-Ph、4-i-Pr-Ph、4-n-Bu-Ph、4-s-Bu-Ph、4-t-Bu-Ph、4-(t-BuCH₂)-Ph、4-Et(Me)₂C-Ph、4-n-Hex-Ph、4-((Me)₂(CN)C)-Ph、4-PhCH₂-Ph、4-(4-F-Ph)(Me)₂C-Ph、4-(MeCH=CH)-Ph、4-(MeC≡C)-Ph、4-CF₃-Ph、4-CF₃CH₂-Ph、4-(Cl₂C=CHCH₂)-Ph、4-(BrC≡C)-Ph、4-(2,2-F₂-c-BuCH₂)-Ph、4-(1-Me-c-Pr)-Ph、4-i-PrO-Ph、4-t-BuO-Ph、4-n-HexO-Ph、4-MeCC(O)Ph、4-(CH₂=CHCH₂O)-Ph、4-CHF₂O-Ph、4-CBrF₂O-Ph、4-CF₃O-Ph、4-CF₃CH₂O-Ph、4-(CF₂=CHCH₂CH₂O)-Ph、4-CCl₃CCH₂O-Ph、4-MeS-Ph、4-s-BuS-Ph、4-EtSO-Ph、4-MeSO₂-Ph、4-EtSO₂-Ph、4-i-PrSO₂-Ph、4-t-BuSO₂-Ph、4-(MeCH=CHCH₂S)-Ph、4-(CH₂=CHCH₂SO)-Ph、4-(ClCH=CHCH₂SO₂)-Ph、4-(HC≡

$\text{CCH}_2\text{S})-\text{Ph}$, $4-(\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{SO}-\text{Ph})$, $4-(\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{SO}_2)-\text{Ph}$, $4-\text{CHF}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-\text{CBrF}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{S}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-\text{CHF}_2\text{CF}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-\text{CHF}_2\text{SO}-\text{Ph}$, $4-\text{CBrF}_2\text{SO}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{SO}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{CH}_2\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-\text{CHF}_2\text{CF}_2\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-\text{CHF}_2\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-\text{CBrF}_2\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-(\text{Cl}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{S})-\text{Ph}$, $4-(\text{Cl}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{SO})-\text{Ph}$, $4-(\text{Cl}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{SO}_2)-\text{Ph}$, $4-(\text{BrC}\equiv\text{CCH}_2\text{S})-\text{Ph}$, $4-(\text{BrC}\equiv\text{CCH}_2\text{SO})-\text{Ph}$, $4-(\text{BrC}\equiv\text{CCH}_2\text{SO}_2)-\text{Ph}$, $4-\text{CHO}-\text{Ph}$, $4-\text{NO}_2-\text{Ph}$, $3-\text{CN}-\text{Ph}$, $4-\text{CN}-\text{Ph}$, $4-(\text{Me})_2\text{N}-\text{Ph}$, $4-\text{Me}(\text{MeC}(\text{O}))\text{N}-\text{Ph}$, $4-\text{PhMeN}-\text{Ph}$, $4-\text{PhCH}_2(\text{MeC}(\text{O}))\text{N}-\text{Ph}$, $4-\text{PhCH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(3-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Me}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(3-\text{Me}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{F}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Et}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-(3-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{SO}-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Me}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{S}-\text{Ph}$, $4-(3-\text{Me}-\text{Ph})\text{CH}_2\text{SO}_2-\text{Ph}$, $4-(2,4-\text{F}_2-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $3-(3,4-\text{Cl}_2-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2,5-\text{Me}_2-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2,3,5,6-\text{F}_4-\text{Ph})\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{MeC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{EtC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{n-PrC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{i-PrC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{i-BuC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{t-BuC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{i-BuCH}_2\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{Et}(\text{Me})_2\text{CC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{n-HexC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{PhC}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Cl}-\text{Ph})\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-(3-\text{Br}-\text{Ph})\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Me}-\text{Ph})\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{MeOCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{EtOCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{i-PrOCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{MeSCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{EtSCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{i-PrSCH}_2-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{CF}_2\text{C}(\text{O})-\text{Ph}$, $4-\text{MeC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{EtC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{n-PrC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{i-PrC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{i-BuC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{t-BuC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{i-BuCH}_2\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{Et}(\text{Me})_2\text{CC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{n-HexC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{CF}_3\text{CF}_2\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $4-\text{PhC}(\text{O})\text{O}-\text{Ph}$, $3-\text{Ph}-\text{Ph}$, $4-\text{Ph}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})-\text{Ph}$, $4-(2,5-\text{Me}_2-\text{Ph})-3-\text{Me}-\text{Ph}$, $3-\text{PhO}-\text{Ph}$, $4-\text{PhO}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{Me}-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{F}-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(4-\text{MeO}-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2,4-\text{Cl}_2-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(3,4-\text{Cl}_2-\text{Ph})\text{O}-\text{Ph}$, $4-(2-\text{Pyridyl})-\text{Ph}$, $4-(5-\text{Cl}-2-\text{Pyridyl})-\text{Ph}$, $2,3-\text{Cl}_2-\text{Ph}$, $3,5-\text{Cl}_2-\text{Ph}$, $2,6-\text{Cl}_2-\text{Ph}$, $2,5-\text{Cl}_2-\text{Ph}$, $2,3-\text{F}_2-\text{Ph}$, $2,5-\text{F}_2-\text{Ph}$, $3,4-\text{F}_2-\text{Ph}$, $3,5-\text{F}_2-\text{Ph}$, $2,4-\text{F}_2-\text{Ph}$, $2-\text{CF}_3-\text{Ph}$, $3-(3-\text{Cl}-\text{PhCH}_2\text{O})-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{CF}_3-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{Cl}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{Me}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{MeO}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{OH}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-6-\text{MeS}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{Cl}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{CF}_3-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{Me}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{MeO}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{OH}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-5-\text{MeS}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-4-\text{Cl}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-4-\text{CF}_3-\text{Ph}$, $2-\text{F}-4-\text{Me}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-4-\text{MeO}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-3-\text{Cl}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-3-\text{Me}-\text{Ph}$, $2-\text{F}-3-\text{MeO}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-2-\text{Cl}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-2-\text{Me}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-2-\text{MeO}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-4-\text{Cl}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-4-\text{Me}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-4-\text{MeO}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-5-\text{Cl}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-5-\text{Me}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-5-\text{MeO}-\text{Ph}$, $3-\text{F}-6-\text{C}$

1-Ph, 3-F-6-Me-Ph, 3-F-6-MeO-Ph, 4-F-2-Cl-Ph, 4-F-2-Me-Ph, 4-F-2-MeO-Ph
 , 4-F-3-Cl-Ph, 4-F-3-Me-Ph, 4-F-3-MeO-Ph, 2,4,6-F₃-Ph, 2-OH-Ph, 4-I-Ph,
 4-MeOC(O)-Ph, 4-MeNHCO-Ph, 2,6-Me₂-Ph, 2,6-(MeO)₂-Ph, 4-(6-F-5-CF₃-2-Pyr
 idyl)-Ph, 4-(2-Pyridyl)O-Ph, 4-(5-Cl-2-Pyridyl)O-Ph, 4-(3-Cl-5-F-2-Pyrid
 yl)O-Ph, 4-(5-Cl-2-Thienyl)O-Ph, 3-CF₃-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 2-MeC(O)-Ph
 , 2-I-Ph, 3-I-Ph, 4-c-Pr-Ph, 4-(2-Cl-c-Pr)-Ph, 4-(2,2-Cl₂-c-Pr)-Ph, 4-(P
 h-CH=CH)-Ph, 4-(Ph-C≡C)-Ph, 4-PhS-Ph, 4-HO-Ph, 4-EtO-Ph, 4-PenO-Ph, 2-F
 -3-CF₃-Ph, 2,3-Me₂-Ph, 3,4-Me₂-Ph, 3,5-Me₂-Ph, 2,3-(MeO)₂-Ph, 2,4-(MeO)₂
 -Ph, 2,5-(MeO)₂-Ph, 3,5-(MeO)₂-Ph, 2-F-3-I-Ph, 2-F-4-I-Ph, 2-F-5-I-Ph, 2
 -F-6-I-Ph, 2-F-4-EtO-Ph, 2-F-4-PrO-Ph, 2-F-4-i-PrO-Ph, 2-F-4-BuO-Ph, 2-F
 -4-s-BuO-Ph, 2-F-4-i-BuO-Ph, 2-F-4-t-BuO-Ph, 2-F-4-PenO-Ph, 2-F-4-(2-Me-
 BuO)-Ph, 2-F-4-(2,2-Me₂-PrO)-Ph, 2-F-4-HexO-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph, 2-
 F-4-Et-Ph, 2-F-4-Pr-Ph, 2-F-4-i-Pr-Ph, 2-F-4-Bu-Ph, 2-F-4-s-Bu-Ph, 2-F-4
 -i-Bu-Ph, 2-F-4-t-Bu-Ph, 2-F-4-Pen-Ph, 2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph, 2-F-4-(2,2-Me
₂-Pr)-Ph, 2-F-4-Hex-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph, 2-F-6-PhS-Ph, 2-F-6-Me₂N-Ph
 , 2-F-6-MeNH-Ph, 2-F-6-Ph-Ph, 3,4-methylenedioxy-Ph, 3,4-ethylenedioxy-P
 h, 2-F-3-Br-Ph, 2-F-4-Br-Ph, 2-F-5-Br-Ph, 2-F-6-Br-Ph, 3-F-2-Br-Ph, 3-F-
 4-Br-Ph, 3-F-5-Br-Ph, 3-F-6-Br-Ph, 4-F-2-Br-Ph, 4-F-3-Br-Ph, 2-Cl-3-Me-P
 h, 2-Cl-4-Me-Ph, 2-Cl-5-Me-Ph, 2-Cl-6-Me-Ph, 3-Cl-2-Me-Ph, 3-Cl-4-Me-Ph
 , 3-Cl-5-Me-Ph, 3-Cl-6-Me-Ph, 4-Cl-2-Me-Ph, 4-Cl-3-Me-Ph, 2,3-F₂-4-Me-Ph
 , 2,3-F₂-5-Me-Ph, 2,3-F₂-6-Me-Ph, 2,4-F₂-3-Me-Ph, 2,4-F₂-5-Me-Ph, 2,4-F₂
 -6-Me-Ph, 2,5-F₂-3-Me-Ph, 2,5-F₂-4-Me-Ph, 2,5-F₂-6-Me-Ph, 2,6-F₂-3-Me-Ph
 , 2,6-F₂-4-Me-Ph, 2,3-F₂-4-Cl-Ph, 2,3-F₂-5-Cl-Ph, 2,3-F₂-6-Cl-Ph, 2,4-F₂
 -3-Cl-Ph, 2,4-F₂-5-Cl-Ph, 2,4-F₂-6-Cl-Ph, 2,5-F₂-3-Cl-Ph, 2,5-F₂-4-Cl-Ph
 , 2,5-F₂-6-Cl-Ph, 2,6-F₂-3-Cl-Ph, 2,6-F₂-4-Cl-Ph, 2,3-F₂-4-MeO-Ph, 2,3-F
₂-5-MeO-Ph, 2,3-F₂-6-MeO-Ph, 2,4-F₂-3-MeO-Ph, 2,4-F₂-5-MeO-Ph, 2,4-F₂-6-
 MeO-Ph, 2,5-F₂-3-MeO-Ph, 2,5-F₂-4-MeO-Ph, 2,5-F₂-6-MeO-Ph, 2,6-F₂-3-MeO-
 Ph, 2,6-F₂-4-MeO-Ph, 2,3-F₂-4-EtO-Ph, 2,3-F₂-5-EtO-Ph, 2,3-F₂-6-EtO-Ph,
 2,4-F₂-3-EtO-Ph, 2,4-F₂-5-EtO-Ph, 2,4-F₂-6-EtO-Ph, 2,5-F₂-3-EtO-Ph, 2,5-

F₂-4-EtO-Ph, 2,5-F₂-6-EtO-Ph, 2,6-F₂-3-EtO-Ph, 2,6-F₂-4-EtO-Ph, 2,3-F₂-4
 -Et-Ph, 2,3-F₂-5-Et-Ph, 2,3-F₂-6-Et-Ph, 2,4-F₂-3-Et-Ph, 2,4-F₂-5-Et-Ph, 2,6-F₂-3
 2,4-F₂-6-Et-Ph, 2,5-F₂-3-Et-Ph, 2,3-F₂-4-Br-Ph, 2,5-F₂-4-Et-Ph, 2,3-F₂-5-Br-Ph, 2,3-F₂-6-Br-Ph,
 -Et-Ph, 2,6-F₂-4-Et-Ph, 2,4-F₂-5-Br-Ph, 2,4-F₂-6-Br-Ph, 2,5-F₂-3-Br-Ph, 2,5-F₂-4
 2,4-F₂-3-Br-Ph, 2,4-F₂-5-Br-Ph, 2,6-F₂-3-Br-Ph, 2,6-F₂-4-Br-Ph, 2,6-F₂-4-Bu-Ph, 2,6-F₂-4-i-Pr-Ph,
 -Br-Ph, 2,5-F₂-6-Br-Ph, 2,6-F₂-4-c-Pr-Ph, 2,6-F₂-4-Bu-Ph, 2,6-F₂-4-i-Bu-Ph, 2,
 2,6-F₂-4-s-Bu-Ph, 2,6-F₂-4-t-Bu-Ph, 2,6-F₂-4-Pen-Ph, 2,6-F₂-4-i-PrO-Ph, 2,6-F
 F₂-4-Ph-Ph, 2,6-F₂-4-PhCH₂-Ph, 2,6-F₂-4-PrO-Ph, 2,6-F₂-4-Hex-Ph, 2,6-F
 2-4-c-PrO-Ph, 2,6-F₂-4-BuO-Ph, 2,6-F₂-4-i-BuO-Ph, 2,6-F₂-4-s-BuO-Ph, 2,6-F
 -F₂-4-t-BuO-Ph, 2,6-F₂-4-PenO-Ph, 2,6-F₂-4-HexO-Ph, 2,6-F₂-4-PhO-Ph, 2,6-F
 -F₂-4-PhCH₂O-Ph, 2-F-6-Cl-3-MeO-Ph, 2-F-6-Cl-4-MeO-Ph, 2-F-6-Cl-5-MeO-Ph, 2-F-6-Cl-3-Cl-P
 , 2-F-6-Cl-3-Me-Ph, 2-F-6-Cl-4-Me-Ph, 2-F-6-Cl-5-Me-Ph, 2-F-6-Cl-3-Cl-P
 h, 2-F-6-MeO-4-Cl-Ph, 2-F-6-MeO-5-Me-Ph, 4-HepO-Ph, 4-OctO-Ph, 4-NonO-Ph, 4-DecO-Ph, 4-
 Me-Ph, 2-F-6-MeO-5-Me-Ph, 4-HepO-Ph, 4-OctO-Ph, 4-NonO-Ph, 4-DecO-Ph, 4-
 UndecO-Ph, 4-DodecO-Ph, 2-Cl-4-HepO-Ph, 2-Cl-4-DodecO-Ph, 2-Cl-4-NonO-Ph, 2-Cl-4-D
 ecO-Ph, 2-Cl-4-UndecO-Ph, 2-Cl-4-DecO-Ph, 2-Cl-4-Hep-Ph, 2-Cl-4-Dodec-Ph, 3-Cl-4-
 , 2-Cl-4-Non-Ph, 2-Cl-4-OctO-Ph, 3-Cl-4-Undec-Ph, 3-Cl-4-DecO-Ph, 3-Cl-4-UndecO-
 -HepO-Ph, 3-Cl-4-OctO-Ph, 3-Cl-4-Hep-Ph, 2-F-4-UndecO-Ph, 2-F-4-DodecO-Ph, 2-F-4-
 Ph, 3-Cl-4-DodecO-Ph, 3-Cl-4-Hep-Ph, 2-F-4-UndecO-Ph, 2-F-4-DodecO-Ph, 2-F-4-
 4-Dec-Ph, 3-Cl-4-Undec-Ph, 3-Cl-4-Dodec-Ph, 2-F-4-UndecO-Ph, 2-F-4-DecO-Ph, 3-
 , 2-F-4-NonO-Ph, 2-F-4-DecO-Ph, 3-F-4-OctO-Ph, 3-F-4-NonO-Ph, 3-F-4-DecO-Ph, 3-
 Hep-Ph, 2-F-4-OctO-Ph, 3-F-4-HepO-Ph, 2-F-4-DodecO-Ph, 2-F-4-
 Dodec-Ph, 3-F-4-HepO-Ph, 3-F-4-DodecO-Ph, 2-Cl-5-MeO-Ph, 2-Cl-6-MeO-Ph, 3-Cl-2-MeO
 F-4-UndecO-Ph, 2-Cl-3-MeO-Ph, 2-Cl-4-MeO-Ph, 3-Cl-5-MeO-Ph, 3-Cl-6-MeO-Ph, 4-Cl-2-MeO-Ph, 3-Cl-3-
 -Ph, 3-Cl-4-MeO-Ph, 2-Me-3-MeO-Ph, 2-Me-4-MeO-Ph, 2-Me-5-MeO-Ph, 2-Me-6-MeO-Ph, 3-Me
 MeO-Ph, 2-Me-3-MeO-Ph, 2-Me-4-MeO-Ph, 2-Me-5-MeO-Ph, 2-Me-6-MeO-Ph, 3-Me

-2-MeO-Ph、3-Me-4-MeO-Ph、3-Me-5-MeO-Ph、3-Me-6-MeO-Ph、4-Me-3-MeO-Ph、3-F-4-Dec-Ph、3-F-4-Undec-Ph、3-F-4-Dodec-Phおよび2,4,6-Me₃-Ph等があげられる。

Y'における、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキル、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニル、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニル、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルカルボニルおよびR^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルカルボニルオキシで定義される、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-1-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

Y' の定義における、R^oで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-t-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

Y' における、R^oで置換されていてもよいフェノキシおよびR^oで置換されていてもよいフェノキシカルボニルで定義される、R^oで置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロ

フェノキシ、2-ブロモフェノキシ、3-ブロモフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

Y' における、R^cで置換されていてもよいヘテロアリール、R^cで置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R^cで置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R^cで置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^cで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルおよびR^cで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシで定義される、R^cで置換されていてもよいヘテロアリールとしては、2-フルオロフラン-3-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-6-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、1-メチルピラゾール-4-イル、1-メチルピラゾール-3-イル、1-フェニルピラゾール-5-イル、1-フェニルピラゾール-4-イル、1-フェニルピラゾール-3-イル、1-メチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、1-メチル-4-フルオロピラゾール-3-イル、1-メチル-3-フルオロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-フルオロピラゾール-5-イル、1-メチル-5-フルオロピラゾール-3-イル、1-メチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、1-メチル-4-クロロピラゾール-5-イル、1-メチル-4-クロロピラゾール-3-イル、1-メチル-3-クロロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イル、1-メチル-5-クロロピラゾール-3-イル、1-メチル-5-クロロピラゾール-

4-イル、1-メチル-3-プロモピラゾール-4-イル、1-メチル-3-フェニルピラゾール-4-イル、1-メチル-5-ニトロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、1-メチル-5-トリフルオロメチルピラゾール-3-イル、1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1-メチル-5-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1-メチル-3-クロロ-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-3-クロロ-4-エトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-4-エトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1,4-ジメチルピラゾール-5-イル、1,4-ジメチルピラゾール-3-イル、1,3-ジメチルピラゾール-4-イル、1,3-ジメチルピラゾール-5-イル、1,5-ジメチルピラゾール-3-イル、1,5-ジメチルピラゾール-4-イル、1,5-ジメチル-4-クロロピラゾール-3-イル、1,3-ジメチル-5-クロロピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、1,3,5-トリメチルピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-4-クロロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-メトキシピラゾール-5-イル、1-メチル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-メチル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、1-フェニル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-フェニル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、1-(2-ピリジル)-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチルピラゾール-4-イル、1-フェニル-5-トリフルオロメチルピラゾール-4-イル、1-フェニル-5-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、1-t-ブチル-5-メチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-クロロ-5-メチルチオピラゾール-4-イル、1-メチルピロール-2-イル、1-メチルピロール-3-イル、1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、5-メチルフラン-2-イル、5-フェニルフラン-2-イル、2,5-ジメチルフラン-3-イル、2,4-ジメチルフラン-3-イル、チオフエン-2-イル、チオフエン-3-イル、5-フェニルチオフエン-2-イル、5-メチルチオフエン-2-イル、5-プロモチオフエン-2-イル、3-プロモチオフエン-2-イル、4,5-ジプロモチオフエン-2-イル、5-ヨードチオフエン-2-イル、5-クロロチオフ

エン-2-イル、5-フェニル-2-メチルチオフエン-3-イル、5-ニトロチオフエン-3-イル、3-メチルチオフエン-2-イル、3-クロロチオフエン-2-イル、3-メトキシチオフエン-2-イル、3-フルオロチオフエン-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、2,4-ジメチルチアゾール-5-イル、2-ブromo-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-エチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、2-メチル-4-エチルチアゾール-5-イル、2-ブromo-4-エチルチアゾール-5-イル、2-エチル-4-メチルチアゾール-5-イル、2-メトキシ-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-フルオロチアゾール-5-イル、2-フェニル-4-エトキシカルボニルチアゾール-5-イル、2-クロロチアゾール-4-イル、2-メチルチアゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル、1,3-ジメチルオキサゾール-5-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-ベンジルオキシ-5-メチルイソチアゾール-4-イル、4-クロロ-5-エトキシカルボニルイソチアゾール-3-イル、イソオキサゾール-5-イル、3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル、5-メチルイソオキサゾール-3-イル、3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル、4-シアノイソオキサゾール-3-イル、1-メチルイミダゾール-5-イル、1-メチル-4,5-ジクロロイミダゾール-2-イル、1,5-ジメチル-2-クロロイミダゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-エチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-ジブromoメチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、4-エチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、6-メチルピリジン-3-イル、6-クロロピリジン-2-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、2-クロロピリジン-4-イル、2-フルオロピリジン-4-イル、2,6-ジクロロピリジン-4-イル、2-メトキシピリジン-4-イル、3,6-ジクロロピリジン-2-イル、2-クロロ-6-メチルピリジン-4-イル、3-フルオロピリジン-2-イル、3-フルオロピリジン-4-イル、キノキサリン-2-イル、6-クロロキノキサリン-2-イル、6-フルオロキノキサリン-2-イル、6-メトキシキノキサリン-2-イル、5-クロロキノキサリン-2-イル、5-フルオロキノキサリン-2-イル、5-メトキシ

キノキサリン-2-イル、1-メチルインドール-3-イル、1-メチル-2-クロロインドール-3-イル、1-メチル-2-フルオロインドール-3-イル、ベンゾチアゾール-2-イル、5-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、6-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、キノリン-4-イル、ピラジン-2-イル、3-クロロピラジン-2-イル、3-メチルピラジン-2-イル、3-エチルピラジン-2-イル、2-フェニル-4-メチルピリミジン-5-イル、2,4-ジメチルピリミジン-5-イル、4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル、4-ジフルオロクロロメチルピリミジン-5-イル、4-ペンタフルオロエチルピリミジン-5-イル、4-メチルチオピリミジン-5-イル、4-プロモジフルオロメチルピリミジン-5-イルおよび2-メチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル等が挙げられる。

Y' の定義における R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2- (3-メチルフラン-2-イル) エチルオキシ、3- (6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピルオキシ、4- (ピリミジン-2-イル) ブチルオキシ、5- (トリアゾール-1-イル) ペンチルオキシおよび6- (ピロール-1-イル) ヘキシルオキシ等が挙げられる。

Y' における、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルフェニル、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルフィニル、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルカルボニルおよび R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルカルボニルオキシで定義される、R^o で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2- (3-メチルフラン-2-イル) エチル、3- (6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピル、4- (ピリミジン-2-イル) ブチル、5- (トリアゾール-1-イル) ペンチルおよび6- (ピロール-1-イル) ヘキシル等が挙げられる。

Y' における、R^aで置換されていてもよいヘテロアリーールオキシおよびR^aで置換されていてもよいヘテロアリーールオキシカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいヘテロアリーールオキシとしては、5-クロロチオフエン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-1-メチルピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3-トリアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

Y' の定義におけるナフチルとしては、1-ナフチルおよび2-ナフチルがあげられる。

R^aおよびY' におけるR^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルおよびR^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルオキシで定義される、R^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチル

ブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチル
 ブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペ
 ンチル、フルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、ジフル
 オロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、トリフルオロ
 メチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル
 、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-プロモエチル、2-ヨ
 ードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエ
 チル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1
 -クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-*i*-プロピ
 ル、1-クロロ-*i*-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフル
 オロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フル
 オロペンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、メトキシメチル、エト
 キシメチル、*n*-プロポキシメチル、*i*-プロポキシメチル、*n*-ブトキシメチル、*i*-
 ブトキシメチル、*s*-ブトキシメチル、*t*-ブトキシメチル、*n*-ペンチルオキシメチ
 ル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピル、メチルチオ
 メチル、エチルチオメチル、*n*-プロピルチオメチル、*i*-プロピルチオメチル、*n*-
 ブチルチオメチル、*i*-ブチルチオメチル、*s*-ブチルチオメチル、*t*-ブチルチオメ
 チル、*n*-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピル、3-
 メチルチオプロピル、ベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロ
 ロベンジル、4-メチルベンジル、4-*i*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メ
 トキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニ
 ルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチ
 ル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニ
 ルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フ
 ェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-
 フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピ
 ル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニ
 ル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル
 、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-

メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル、ピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルおよび6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルケニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルケニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルケニルスルフィニルおよびR^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルケニルスルホニルで定義される、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル

ル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルキニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルキニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルキニルスルフィニル、およびR^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルキニルスルホニルで定義される、R^bで置換されていてもよいC₂~C₆アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、ブロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-ブロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシカルボニルで定義される、R^bで置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,

2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、1-フルオロ-*i*-プロポキシ、1-クロロ-*i*-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ、ベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-*t*-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ

、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシおよび6-(ピロール-1-イル)ヘキシルオキシ等が挙げられる。

R'およびY'の定義におけるR'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デカニル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、2-エチルヘキシル、フルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル

、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-*i*-プロピル、1-クロロ-*i*-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フルオロペンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、7-フルオロヘプチル、8-クロロオクチル、メトキシメチル、エトキシメチル、*n*-プロポキシメチル、*i*-プロポキシメチル、*n*-ブトキシメチル、*i*-ブトキシメチル、*s*-ブトキシメチル、*t*-ブトキシメチル、*n*-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、*n*-プロピルチオメチル、*i*-プロピルチオメチル、*n*-ブチルチオメチル、*i*-ブチルチオメチル、*s*-ブチルチオメチル、*t*-ブチルチオメチル、*n*-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピル、3-メチルチオプロピル、ベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-*t*-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニル

ヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル、ピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、2,2-ジクロロシクロプロピルメチル、1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチル、テトラヒドロピラン-2-イルメチル、イミダゾール-1-イルメチル、2-ジフルオロメトキシエチル、2-メチルスルフェニルエチル、3-シアノプロピル、2-ホルミル-2-メチルプロピル、4-メトキシカルボニル-4-シアノブチル、5-(2-クロロフェニル)ペンチル、1-フェニル-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-エトキシメチル、1-(2-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-クロロメチル、1-フェニル-1,1-ジメトキシメチルおよび6-ホルホルノヘキシル等が挙げられる。

‘R’および‘Y’の定義におけるR^bで置換されていてもよいC₁~C₁₂アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、6-ヘプテニル、7-オクテニル、8-ノネニル、9-デセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル

、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロベニル、1-エチル-1-メチル-2-プロベニル、2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロベニル、3-フルオロ-2-プロベニル、3-ブロモ-2-プロベニル、3-ヨード-2-プロベニル、3,3-ジクロロ-2-プロベニル、3,3-ジフルオロ-2-プロベニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニル、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、3-シアノ-2-プロベニル、4-(4-クロロフェニル)-4-エトキシカルボニル-3-ブテニル、3-(チアゾール-2-カルボニルオキシ)-4-メトキシ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、2-(4-クロロフェニル)エテニル、2-(3-クロロフェニル)エテニル、2-(2-クロロフェニル)エテニル、2-(4-フルオロフェニル)エテニル、2-(3-フルオロフェニル)エテニル、2-(2-フルオロフェニル)エテニル、2-(4-メチルフェニル)エテニル、2-(3-メチルフェニル)エテニル、2-(2-メチルフェニル)エテニル、2-フェニル-1,2-ジブロモエテニルおよび6-(ピラゾール-1-イル)-3-ヘキセニル等が挙げられる。

R^aおよびY'の定義におけるR^bで置換されていてもよいC₂~C₁₂アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1

-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、プロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-プロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニル、6-ヨード-5-ヘキシニル、4-(2-クロロチアゾール-5-イル)-3-ブチニル、5-ホルミル-3-ペンチニル、6-メチルスルフェニル-5-ヘキシニル、2-フェニルエチニルおよび3-シアノ-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R^oおよびY^oの定義におけるR^bで置換されていてもよいC₁~C₁₂アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシ、n-ノニルオキシ、n-デカニルオキシ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-プロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-プロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-プロモプロポキシ、1-フルオロ-i-プロポキシ、1-クロロ-i-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフル

オロプロボキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロボキシ、4-クロロプトキシ、4-フルオロプトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ、ベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-プロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-*t*-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル)

ペンチルオキシ、

6-（ピロール-1-イル）ヘキシルオキシ、1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチルオキシ、テトラヒドロピラン-2-イルメチルオキシ、イミダゾール-1-イルメチルオキシ、2-ジフルオロメトキシエチルオキシ、2-メチルスルフェニルエチルオキシ、3-シアノプロピルオキシ、2-ホルミル-2-メチルプロピルオキシ、4-メトキシカルボニル-4-シアノブチルオキシ、5-（2-クロロフェニル）ペンチルオキシおよび6-モルホリノヘキシルオキシ等が挙げられる。

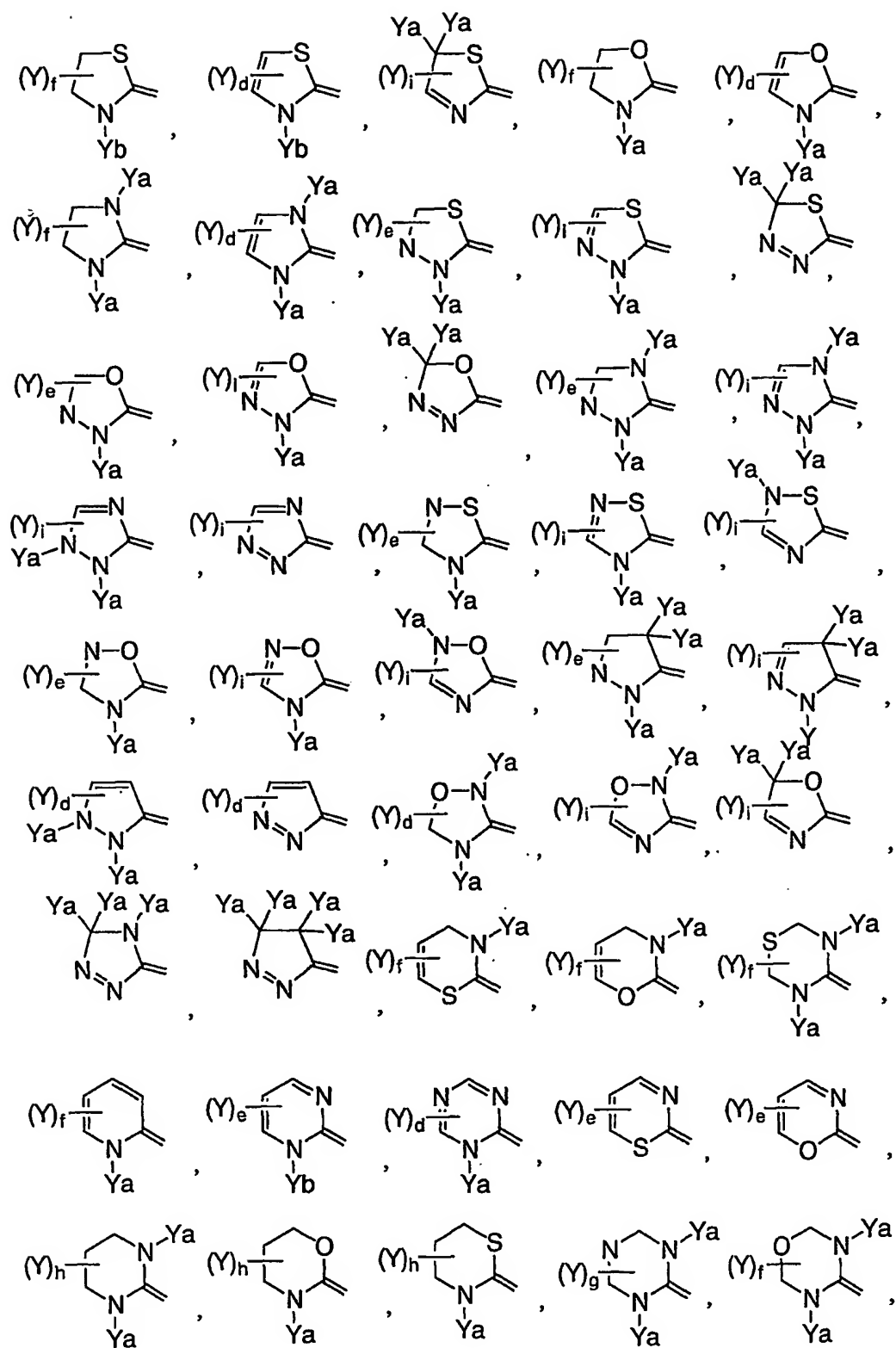
R^aおよびY^aの定義におけるR^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシとしては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、i-プロポキシメトキシ、n-ブトキシメトキシ、i-ブトキシメトキシ、s-ブトキシメトキシ、t-ブトキシメトキシ、n-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシ、3-メトキシプロポキシ、シアノメトキシメトキシ、2-（2-ニトロエトキシ）エトキシ、3-（1-メチルピラゾール-5-イルメトキシ）プロピルオキシ、4-（3-シアノ-2-メチルプロピルオキシ）ブトキシ、5-ベンジルオキシペンチルオキシおよび5-（2-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル）メトキシヘキシルオキシ等が挙げられる。

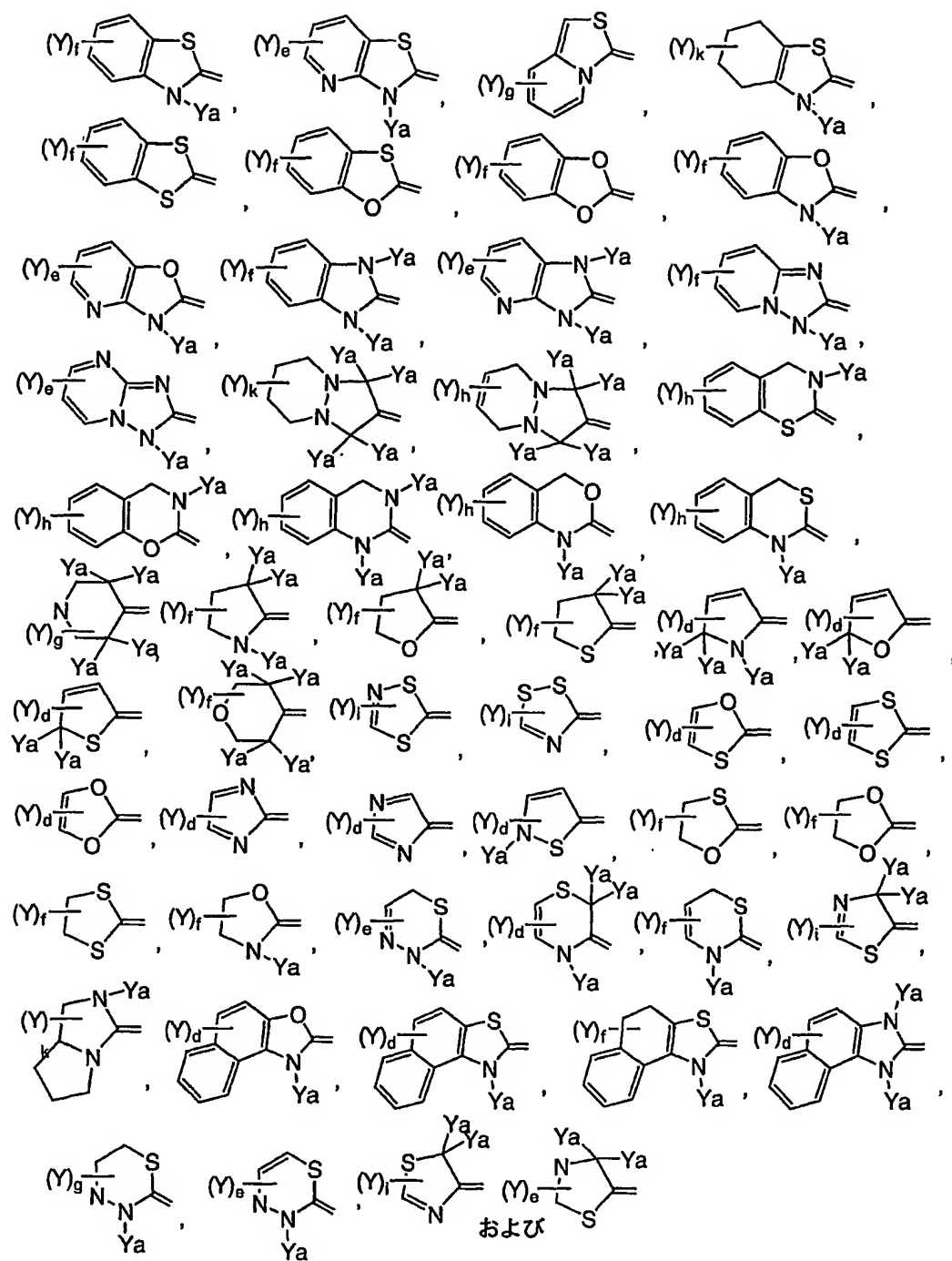
Yの定義における、Aの同一炭素上に置換した2個のYにより該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1から3個含んでもよい3から7員環としては、シクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル、シクロブチル、オキセタンおよびシクロペンチル等が挙げられる。

R²およびR³の定義における、R²およびR³とが一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでもよい3から7員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

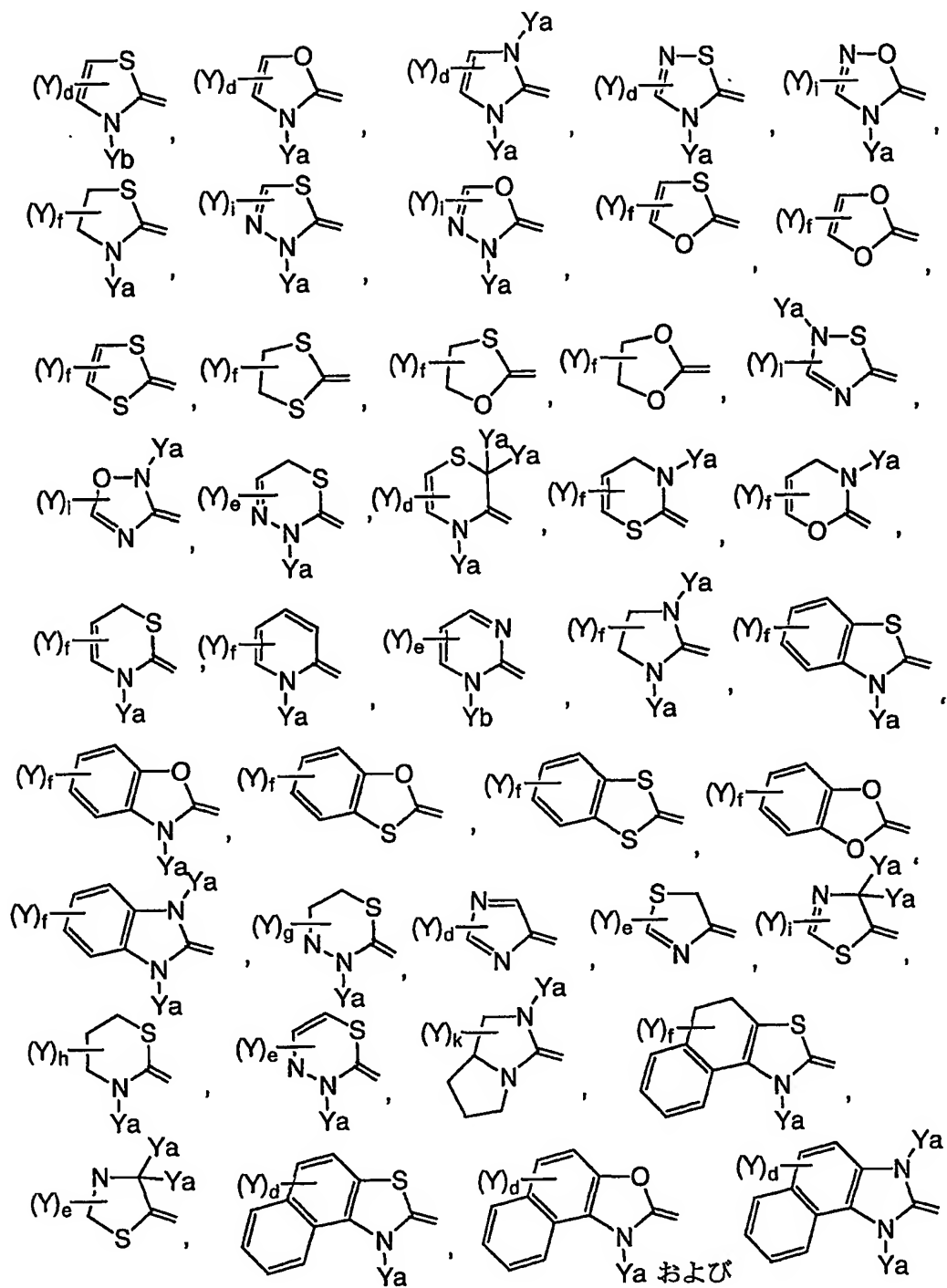
U¹およびU²の定義における、U¹およびU²とが一緒になって形成する、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでもよい3から7員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

Aとしては、好ましくは、

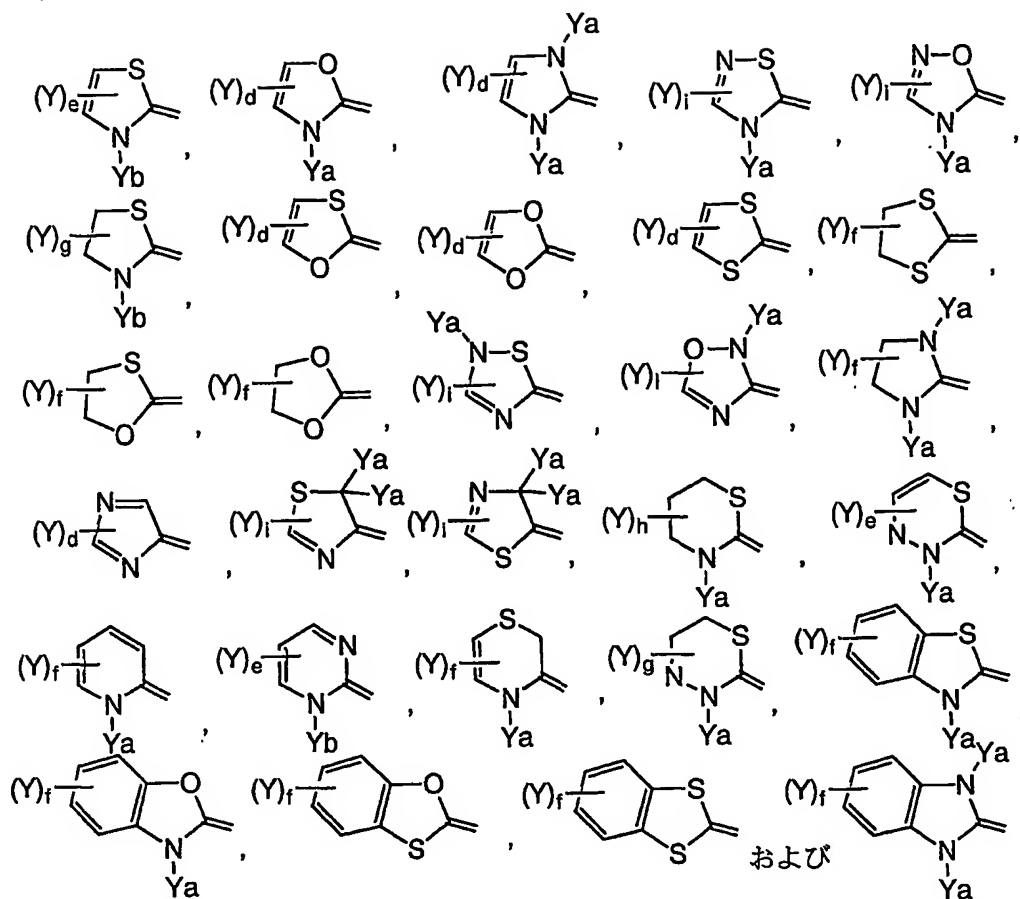




が挙げられ、更に好ましくは



が挙げられ、特に好ましくは



が挙げられる。なお、Y、Ya、Yb、d、e、f、g、h、i、jおよびkは前記と同様の意味を表す。

Bとしては $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}^4)-$ または $-\text{C}(=\text{N}-\text{OR}^4)-$ が挙げられる。

R^1 としては、好ましくは水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R^2 としては、好ましくは、水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R^3 としては、好ましくは、水素原子、メチル、エチル、 R^4 で置換されていてよいフェニルおよび R^4 で置換されていてよいベンジル等が挙げられ、より

好ましくは水素原子、R^aで置換されていてもよいフェニルおよびメチルが挙げられる。

R^aとしては、水素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R^bとしては、水素原子、メチル、アセチル、フェニルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルおよびアセチルが挙げられる。

R^cとしては、水素原子、塩素原子、メチル、エチル、メトキシカルボニル、メチルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルおよびベンジル等が挙げられる。

R^dとしては、R^aで置換されていてもよいフェニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、水素原子、メチル、エチル、メトキシ、ベンジルオキシ、アセチルおよびR^aで置換されていてもよいベンジル等が挙げられる。

R^eおよびR^fとしては、水素原子、塩素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられる。

R^gとしては、水素原子、塩素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

R^hとしては、水素原子、メチルおよびエチル等が挙げられる。

Rⁱとしては、水素原子およびメチル等が挙げられる。

R^jとしては、水素原子、塩素原子、臭素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

R^kとしては、好ましくは、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆ハロアルコキシ、CN、ニトロおよびC₁~C₆アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、Cl、F、Br、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、エチル、プロピルおよびメチルが挙げられる。

R^lとしては、好ましくは、ハロゲン原子、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、CN、ニトロおよびC₁~C₆アルコキシカルボニル等が挙げられる。

R^mとしては、好ましくは、ハロゲン原子、R^aで置換されていてもよいフェニ

ル、 R^a で置換されていてもよいヘテロアリール、 R^a で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R^a で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 R^b で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^b で置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^b で置換されていてもよい $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^b で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R^b で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、CN、ニトロ、OH、SH、SCNおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル等が挙げられる。

Xとしては、好ましくは、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、CN、ニトロ、 $S-R$ 、 NU^1U^2 、 R^a で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、Cl、F、I、Br、メトキシ、エチル、*n*-プロピル、エトキシ、*n*-プロポキシ、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メトキシカルボニル、ペンタフルオロエチル、エトキシカルボニル、CN、アセチルおよびメチルが挙げられる。

Y'としては、好ましくは、水素原子、ハロゲン原子、 R^b で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^b で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R^c で置換されていてもよいフェニル、 R^c で置換されていてもよいフェノキシ、 R^c で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^c で置換されていてもよいヘテロアリール、CN、ニトロおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル等が挙げられる。

U^1 および U^2 としては、好ましくは、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、H、メチル、フェニル、ベンジル、アセチル、メトキシカルボニルが挙げられる。

Dとしては、好ましくは、単結合、 $-C(=Q^2)-$ および $-C(R^d)=N-O-$ が挙げられる。

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 としては、好ましくは、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N-R^7$ および $=CH_2$ である。

Q⁴およびQ⁵としては、好ましくは、=Oおよび=Sである。

Q⁶としては、好ましくは、-O-および-S-である。

Q⁷としては、好ましくは、=N-および=CH-である。

Gとしては、G¹, G², G³, G⁴, G⁵, G⁶, G⁷, G⁸, G¹⁵およびG¹⁶が挙げられ、好ましくは、G¹, G², G³, G⁴, G¹⁵およびG¹⁶であり、さらに好ましくは、G¹およびG¹⁵である。

Bとしては、-CH₂-, -C(=CH-OR⁴)-および-C(=N-OR⁴)-が挙げられる。

B¹としては、好ましくは、-N(OR⁴)-, -N(R⁵)-, -O-および-S-等が挙げられ、さらに好ましくは、-N(OR⁴)-および-N(R⁵)-が挙げられる。

B²としては、好ましくは、-CH₂-, -C(=CH-OR⁴)-, -C(=N-OR⁴)-および-CH(OR⁴)-等が挙げられる。

A²としては、好ましくは、A²aが挙げられる。

nは好ましくは0、1または2である。

pは好ましくは0または1である。

本願発明のヘテロ環イミノフェニル化合物の農薬として許容される塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩、アンモニウム塩、イソプロピルアミン塩およびシュウ酸塩等が挙げられる。

また、本発明化合物は、互変異性により式(1)のイミノ結合が変化しないものが好ましい。

次に、本発明化合物の防除対象となる植物病害としては、

イネのいもち病(*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病(*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、

ムギ類のうどんこ病(*Erysiphe graminis*, f. sp. *hordei*, f. sp. *tritici*)、斑葉病(*Pyrenophora graminea*)、網斑病(*Pyrenophora teres*)、赤かび病(*Gibberella zeae*)、さび病(*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病(*Typhula* sp., *Micronectriella nivais*)、裸黒穂病(*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、アイスボット(*Pseudocercospora herpotrichidis*)

ichoides)、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病 (*Septoria tritici*)、
ふ枯病 (*Leptosphaeria nodorum*)、
カンキツの黒点病 (*Diaporthe citri*)、そうか病 (*Elsinoe fawcetti*)、果実
腐敗病 (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、
リンゴのモニリア病 (*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、うどんこ
病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、黒星病 (*Ven-
turia inaequalis*)、
ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*)、黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、赤
星病 (*Gymnosporangium haraeaeum*)、
モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)
、フオモプシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.)、
ブドウのべと病 (*Plasmopara viticola*)、黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、晩
腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、さび病 (*Ph-
akopsora ampelopsidis*)、
カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病 (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerel-
la nawae*)、
ウリ類のべと病 (*Pseudoperenospora cubensis*)、炭そ病 (*Colletotrichum lag-
enarium*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerell-
a melonis*)、
トマトの疫病 (*Phytophthora infestans*)、輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉
かび病 (*Cladosporium fulvam*)、
ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracoarum*)、
アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cerocosporella br-
assicae*)、
ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、
ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒
点病 (*Diaporthe phaseololum*)、
インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemuthianum*)、
ラッカセイの黒渋病 (*Mycosphaerella personatum*)、褐斑病 (*Cercospora arac*

hidicola)、
エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、
ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、
イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、
チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)
、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、
バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、
キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemiindici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、
種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、種々の作物の菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等が挙げられる。

また、本発明化合物は、農園芸作物および樹木等を加害するいわゆる農業害虫、家畜家禽類に寄生するいわゆる家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与えるいわゆる衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害するいわゆる貯穀害虫、および同様の場面で発生加害するダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類のいずれの害虫も低濃度で有効に防除できる。

本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類には具体的には次に示すものがあるが、それらのみに限定されるものではない。

ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、フタオビコヤガ (*Nerenga aenescens*)、イチモンジセセリ (*Parnara guttata*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモンジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes sp.*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、モモシンクイ (*Carposina niponensis*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringon*)

ie) 、コットンボールワーム (*Helicoverpa zea*) 、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens*) 、ヨーロッパコンボラー (*Ostrinia nubilalis*) 、フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*) 、コドリンガ (*Cydia pomonella*) 及びアメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) などの鱗翅目害虫、

ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) 、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) 、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) 、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*) 、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia tabaci*) 、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*) 、ツツジグンバイ (*Stephantia pyriodes*) 、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*) 、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*) 、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*) 、オオワラジカイガラムシ (*Drosicha corpulenta*) 、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 、ナガメ (*Eurydema rugosum*) 及びナンキンムシ (*Cimex lectularis*) などの半翅目害虫、

ニジュウヤホシテントウ (*Henosepilachna vigintioctopunctata*) 、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*) 、マメコガネ (*Popillia japonica*) 、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*) 、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus vestitus*) 、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*) 、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*) 、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*) 、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) 、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*) 、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*) 、カンシャコメツキ (*Melanotus tamsuyensis*) 、ヒメヒラタケシキスイ (*Europea domina*) 、コーンルーツワーム (*Diabrotica* spp.) 、ココクゾウ (*Sitophilus oryzae*) 、グラナリーウィービル (*Sitophilus granarius*) 及びコクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*) などの鞘翅目害虫、

マメハモグリバエ (*Liriomyza trifoli*) 、タネバエ (*Delia platura*) 、ヘシアフライ (*Mayetiola destructor*) 、ウリミバエ (*Dacus (Zengodacus) cucurbitae*) 、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*) 、イエバエ (*Musca domestica*) 、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*) 、ヒツジシラミバエ (*Melophagus orinus*) 、キスジウシバエ (*Hypoderm lineatum*) 、ウシバエ (*Hypoderma boris*) 、

ヒツジバエ (*Oestrus ovis*)、ツエツツエバエ (*Golossina palpais*)、キアシオオブユ (*Prosimulium yezoensis*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、オオチヨウバエ (*Telmatoscopus albipunctatus*)、トクナガクロヌカカ (*Leptoconops nipponensis*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 及びシナハマダラカ (*Anopheles culicifacies*) などの双翅目害虫、

カブラハバチ (*Athalis rosae ruficornis*)、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*)、クリハバチ (*Apethymus kuri*)、グンタイアリ、クロオオアリ (*Camponotus japonicus*)、オオスズメバチ (*Vespa mandarina*)、ブルドックアント、ファイヤーアント及びファラオアントなどの膜翅目害虫、

ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) 及びチャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*) などの総翅目害虫、

クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*) 及びチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) などの網翅目害虫、

ケラ (*Gryllotalpa africana*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*) 及びサバクワタリバッタ (*Schistocerca gregaria*) などの直翅目害虫、

イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Leucotermes speratus*) 及びタイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*) などのシロアリ目害虫、

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*) 及びケオブスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) などの等翅目害虫、

ニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*) 及びウシハジラミ (*Bovicola bovis*) などのハジラミ目害虫、

ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*) 及びケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) などのシラミ目害虫、

ヤマトシミ (*Ctenolepisma villosa*) などの総尾目害虫、
ヒラタチャタテ (*Liposcelis bostrychophilus*) などの嚙虫目害虫、
ヤギシロトビムシ (*Onychiurus pseudarmatus yagii*) 及びシロトビムシ (*Onychiuridae*) などの粘管目害虫、
ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) 及びカンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*) などのハダニ類、
ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、ニセナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*) 及びチャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*) などのフシダニ類、
チャノホコリダニ (*Ppolyphagotarsonemus latus*) 及びシクラメンホコリダニなどのホコリダニ類、
ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*) 及びロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*) などのコナダニ類、
ミツパチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) などのハチダニ類、
オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 及びフタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) などのマダニ類、
ヒツジキュウセンダニなどのキュウセンダニ類、
ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) などのヒゼンダニ類、
トビズムカデ、アカズムカデ (*Scelopendra subspinipes japonica*)、ゲジ (*Theureuronema hilgendorfi*) などの唇脚類、
ヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*)、フジヤスデなどの倍脚類、
サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及びマツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) などの線虫類、
スクミリンゴガイ (*Pomacea canaliculata*)、ナメクジ (*Incilaria pilineata*)、アフリカマイマイ (*Achatina fulica*)、ウスカワマイマイ (*Acusta despecta*)

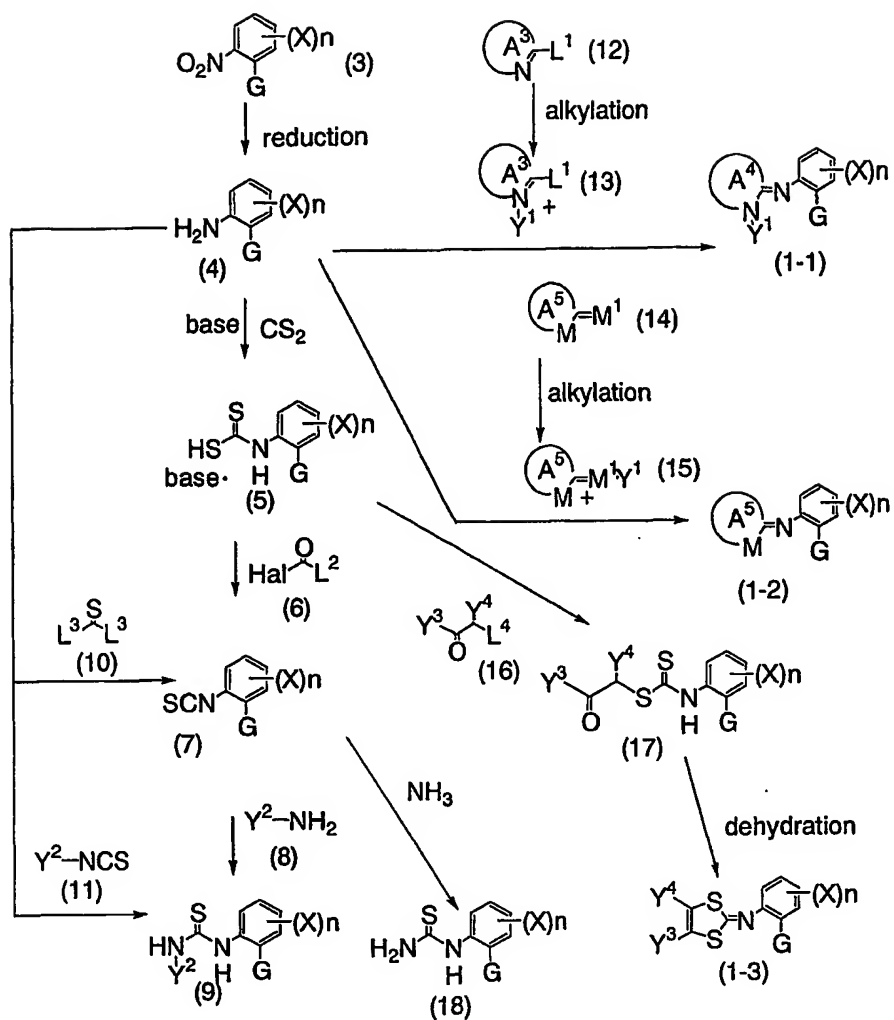
sieboldiana) 及びミスジマイマイ (*Euhadra peliomphala*) などの軟体動物、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare latreille*) などの甲殻類があげられる。

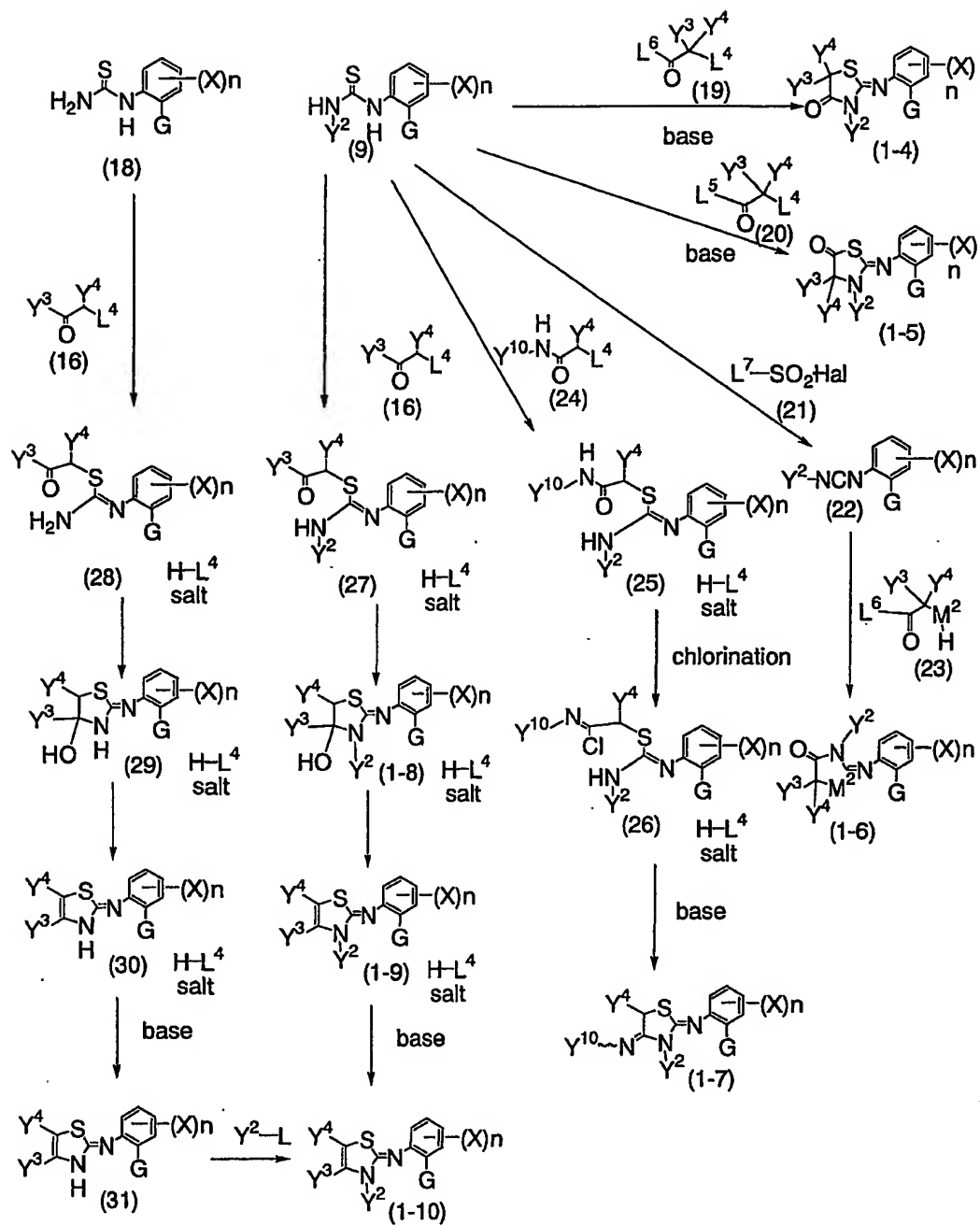
また、本発明化合物は極めて低い濃度で水中生物の付着防止に効果を示す。その水中生物としては、例えばムラサキイガイ、フジツボ、カキ、ヒドロムシ、ヒドラ、セルプラ、ホヤ、コケムシ、フサコケムシ、タニシ、アオサ、アオノリ、シオミドロ等の貝類及び藻類等があげられる。

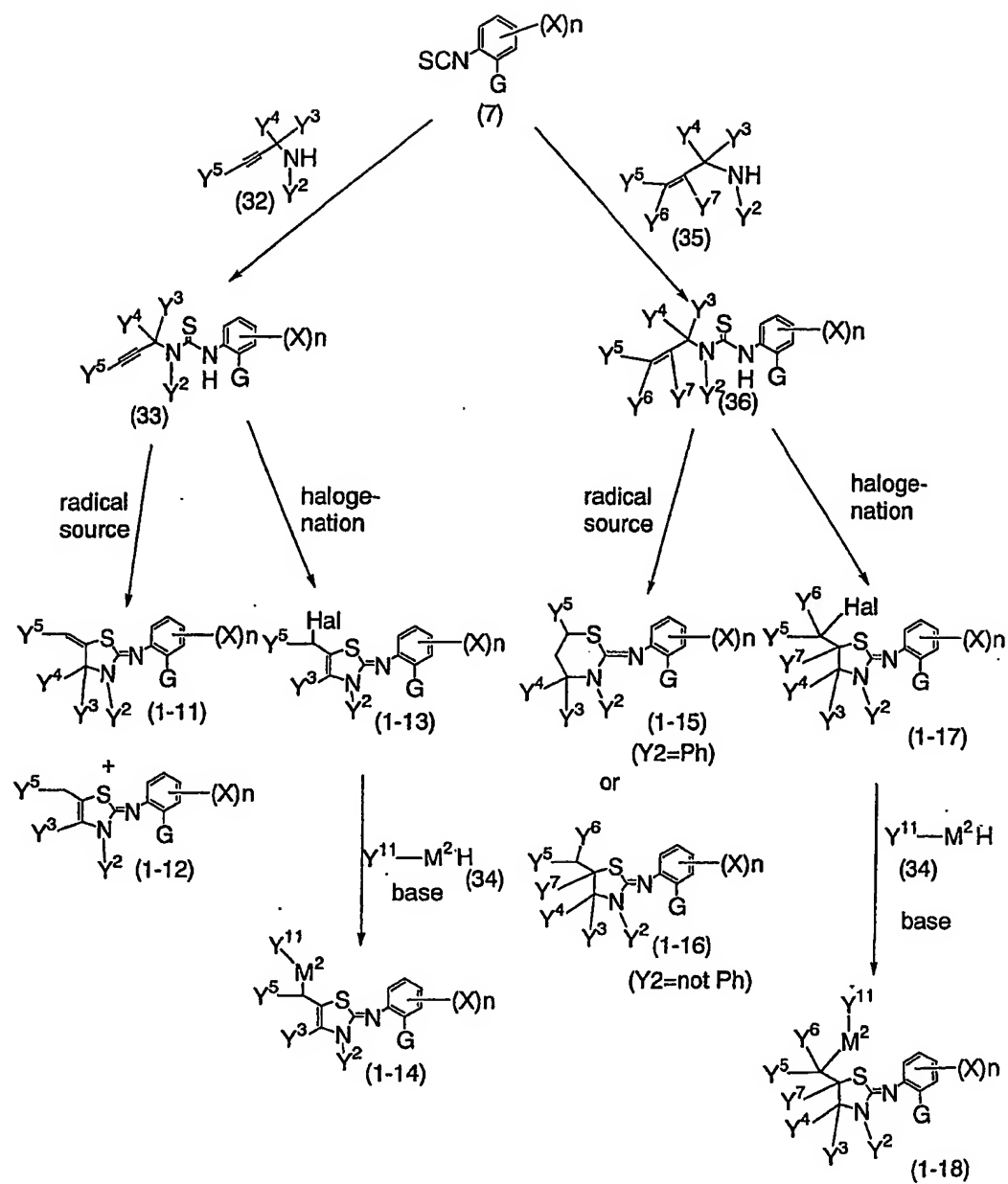
すなわち、本発明化合物は直翅目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、シロアリ目およびダニ・シラミ類の害虫や植物病害を低濃度で有効に防除できる。更に、本発明化合物は海水及び淡水中における各種の水中生物の水中構築物等への付着を防除できる。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類および益虫に対してほとんど悪影響がない極めて有用な化合物を含む。

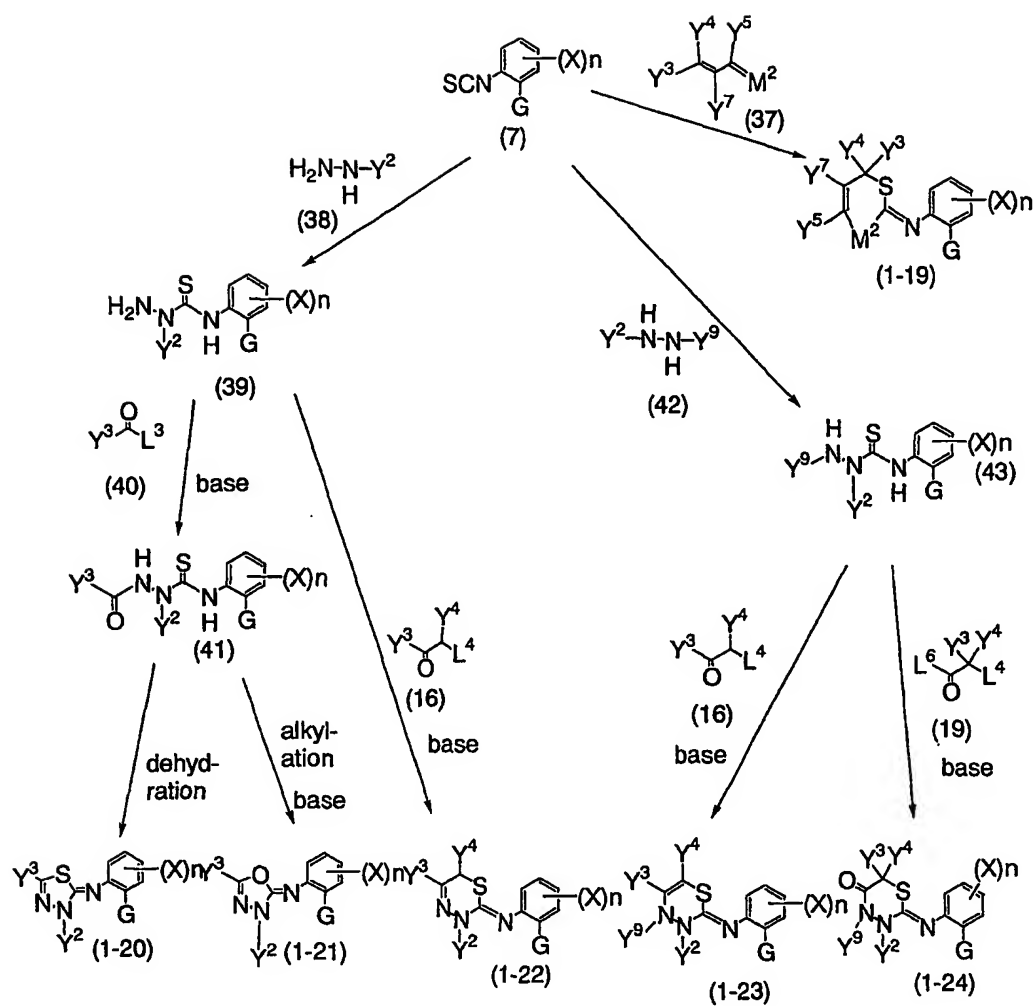
次に、前記(1)で表される本発明化合物の製造法を以下に説明する。

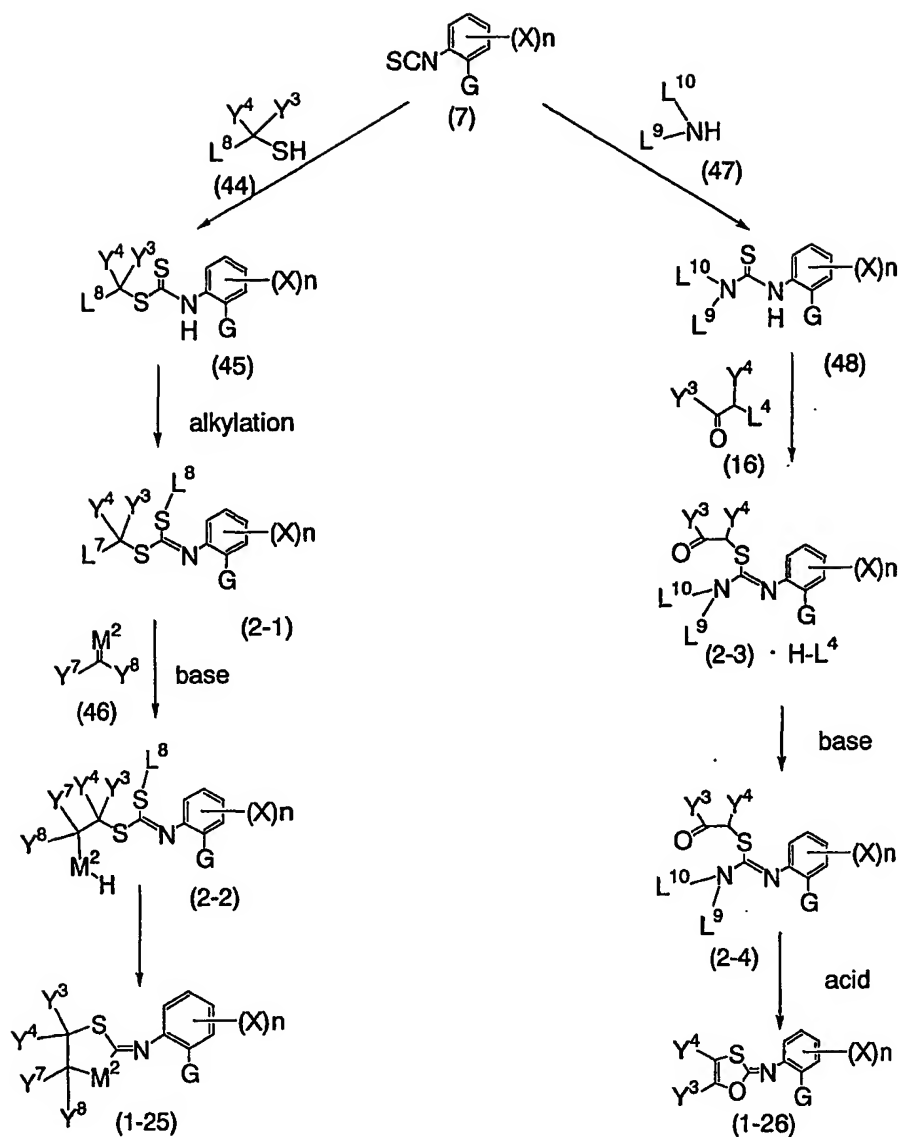
(製造法1)











(A³およびA⁴は、各々独立に、前記Aと同様の意味を表し、但し、窒素原子を脱離基L¹またはイミノ結合のα位に有する環であり、A⁵は、前記Aと同様の意味を表し、但し、酸素原子、硫黄原子または窒素原子をC=M¹またはイミノ結合のα位に有する環である。Xおよびnは前述と同じ意味を表す。L¹は、良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルコキシ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミノ、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1～4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニル

オキシ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L²およびL⁶は、良好な脱離基例えば、炭素数1～4のアルコキシ、炭素数1～4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L³は、各々独立に、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルコキシ、炭素数1～4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L⁴は、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1～4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシまたはトルエンスルホニルオキシ等である。L⁵は、良好な脱離基例えば、塩素原子または臭素原子等である。L⁷は、炭素数1～4のアルキル基、フェニルまたはトリイル基等である。L⁸は、水素原子、トリメチルシリル基、ターシャリーブチルジメチルシリル基またはターシャリーブチルジフェニルシリル基等である。L⁹およびL¹⁰は、各々独立に、Yと同じ意味を表すかまたは一緒になって、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-ピペリジニルまたはモルホリノを表す。Y¹は、炭素数1～6のアルキル基またはR^aで置換されていてもよいベンジル基を表す。Y²、Y⁹およびY¹⁰は、各々独立に、Yと同じ意味を表す。Y³、Y⁴、Y⁷、Y⁸およびY¹¹は、各々独立に、水素原子かまたは、Yと同じ意味を表す。Y⁵およびY⁶は、各々独立に、水素原子、炭素数1～6のアルキル基またはR^aで置換されていてもよいフェニル基を表す。Mは、酸素原子、硫黄原子またはN-Y²を表す。M¹は、酸素原子または硫黄原子を表す。M²は、酸素原子、硫黄原子またはN-Y⁹を表す。Halは、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子またはフッ素原子を表す。R^aは、前述と同じ意味を表す。Gは、前述と同じ意味を表す。）

ニトロ化合物(3)から式(9)で表される化合物を製造する方法としては、ヨーロッパ特許出願公報(EP-447118号公報)、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プリパレーションズ(Organic Functional Group Preparations)(Academic社)第1巻、313頁(1968年)、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・

ソサエティー (J. Am. Chem. Soc.) 第54巻、781頁 (1932年)、ケミカル・レビュー (Chem. Rev.) 第55巻、181頁 (1955年) 等に記載の方法を用いることができる。すなわち、ニトロ化合物 (3) の還元反応によりアミノ化合物 (4) へと変換した後、塩基存在下、二硫化炭素と反応させることにより、ジチオカルバミン酸化合物 (5) へと変換し、さらに、ジチオカルバミン酸化合物 (5) を、式 (6) で表される酸ハライド化合物と反応させることにより、イソチオシアネート化合物 (7) へと変換した後、イソチオシアネート化合物 (7) を式 (8) で表されるアミン化合物と反応させることで、チオウレア化合物 (9) を製造することが出来る。このとき、アミン化合物として、アンモニアを用いることで、同様にチオウレア化合物 (18) を製造することもできる。また、イソチオシアネート化合物 (7) は、アミノ化合物 (4) を式 (10) で表されるチオカルボニル化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。また、チオウレア化合物 (9) はアミノ化合物 (4) と式 (11) で表されるイソチオシアネート化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。さらに、チオウレア化合物 (9) は、シンセティック・コミュニケーション (Synth. Commun.) 第25巻1号、43頁 (1995年) に記載の方法を用いて、スルホン酸ハライド化合物 (21) と反応させることにより、カルボジイミド化合物 (22) へと変換することができる。

本発明化合物 (1-1) および (1-2) は、アミノ化合物 (4) を原料にアングバンテ・シェミー (Angew. Chem.) 第80巻、799頁 (1968年) に記載の方法あるいはその方法に準じて製造することが出来る。すなわち本発明化合物 (1-1) は、予め式 (12) で表される化合物をアルキル化し式 (13) で表されるアンモニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、アミノ化合物 (4) と反応させることにより製造できる。同様に、本発明化合物 (1-2) は、予め式 (14) で表される化合物をアルキル化し式 (15) で表されるオキシニウム塩またはチオキシニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、アミノ化合物 (4) と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例

えば、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロボウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボウ酸塩等が挙げられる。触媒としては、例えば、酸化銀、トリフルオロメタンスルホン酸銀塩等が挙げられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から300時間の範囲で行うことができ、1時間から168時間の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(12)または(14)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(13)または(15)は(4)に対して、0.5から5.0当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-3)は、ジチオカルバミン酸化合物(5)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによってジチオカルバミン酸エステル化合物(17)へと変換した後、さらに必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤と反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N

ーメチルピロリドン、N，N'－ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N－メチルピペリジン、4－ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ－N－ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、－80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(5)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(5)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(17)に対して、0.1から100当量の範囲で用いることができ、1から50当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1－4)は、チオウレア化合物(9)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N－メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂

脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(9)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(19)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-5)は、チオウレア化合物(9)と式(20)で表される酸ハロゲン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機

塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(9)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(20)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-6)は、カルボジイミド化合物(22)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物(23)と反応させることによって製造することができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(22)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(23)

は(22)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-7)は、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを反応させることにより得られる。すなわち、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプソイドチオウレア化合物(25)へと変換できる。さらに、プソイドチオウレア化合物(25)は、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤により処理することによって、イミドイルクロライド化合物(26)へと変換できる。さらに(26)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、本発明化合物(1-7)へと変換できる。また、(25)とハロゲン化剤との反応で、塩基を用いることにより、(26)を単離することなく、(1-7)を得ることもできる。(9)から(25)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(24)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。(25)から(26)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であれ

ばよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。ハロゲン化剤としては、テトラクロロエタン/トリフェニルホスフィン、オキシ塩化リン、5 塩化リン、3 塩化リン、シュウ酸ジクロライド、塩素、N-クロロこはく酸イミド等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩素化剤の当量としては、(25)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。(26)から(1-7)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナ

トリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(26)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-10)は、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを反応させることにより得られる。すなわち、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプソイドチオウレア化合物(27)へと変換できる。さらに、プソイドチオウレア化合物(27)は、必要に応じて溶媒中、酸あるいは塩基性触媒存在下、反応させることにより、ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)へと変換できる。さらに(1-8)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-9)へと変換できる。さらに、(1-9)は、必要に応じて溶媒中、塩基で処理することにより、遊離の化合物(1-10)へと変換できる。また、(9)と(16)との反応で、長時間、あるいは加熱処理あるいは触媒を用いて処理することにより、(27)または(1-8)を単離することなく(1-9)を得ることもできる。また、(9)と(16)との反応で、塩基を用いることにより、(27)または(1-8)または(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。また、(1-8)と脱水剤との反応で、塩基を用いることにより、(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。また、チオウレア化合物(18)から同様に得られるチアゾリン化合物(31)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤で処理することによっても得られる。

(9)から(1-8)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセ

トン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。酸性触媒としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、フッ化水素酸、酢酸、テトラフルオロホウ酸等が挙げられる。塩基性触媒としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(16)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)から本発明化合物(1-9)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナト

リウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。脱水剤としては、メタンスルホンクロライド、トルエンスルホンクロライド、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。また、トルエン、ベンゼン、キシレン等の溶媒を用いて、共沸脱水により反応させることもできる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-8)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(1-8)に対して、0.1から100当量の範囲で用いることができ、1から50当量の範囲が好ましい。(1-9)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ

、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-9)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。(31)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(31)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(31)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-11)および(1-12)は、以下のような方法により製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(32)で表される

プロパルギルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式(33)で表されるプロパルギルチオウレア化合物へ変換できる。さらに、(33)は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、(1-11)と(1-12)の混合物を得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはテトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アゾビスイソブチロニトリル等が用いられる。また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(32)は(7)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-13)は、前述のプロパルギルチオウレア化合物(33)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、

ハロゲン化剤で処理することにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモこはく酸イミド、N-クロロこはく酸イミド、N-ヨードこはく酸イミド、テトラブチルアンモニウムトリブロマイド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(33)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。ハロゲン化剤の当量としては、(33)に対して0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-14)は、前述の(1-13)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジ

メトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-13)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(34)は(1-13)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-15)および(1-16)は、以下のような方法により製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(35)で表されるアリルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式(36)で表されるアリルチオウレア化合物へ変換できる。さらに、(36)は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、 Y^2 がフェニルの場合は本発明化合物(1-15)を、 Y^2 がフェニル以外の場合は本発明化合物(1-16)をそれぞれ得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン

、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アゾビスイソブチロニトリル等が用いられる。また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(35)は(7)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-17)は、前述のアリルチオウレア化合物(36)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤で処理することにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等の

ニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモコハク酸イミド、N-クロロコハク酸イミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(36)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。ハロゲン化剤の当量としては、(36)に対して0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-18)は、前述の(1-17)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラ

ン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビスクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-17)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(34)は(1-17)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-19)は、シンセシス(Synthesis)896頁(1981年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(37)で表されるオレフィン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。触媒とし

ては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(37)は(7)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-20)は、西ドイツ特許出願公報(DE-3025559号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(38)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(39)へ変換できる。さらに式(40)で表されるカルボニル化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては、触媒存在下、反応させることで、アシルチオセミカルバジド化合物(41)へと変換することができる。さらに、アシルチオセミカルバジド化合物(41)を必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-20)を得ることができる。

イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(39)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルア

ンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(38)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

チオセミカルバジド化合物(39)からアシルチオセミカルバジド化合物(41)へ変換する反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(39)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(40)は(39)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

アシルチオセミカルバジド化合物(41)から、本発明化合物(1-20)を得

る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ベンゼン、キシレン、クロロホルム等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、5-塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、脱水剤は(41)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-21)は、西ドイツ特許出願公報(DE-3025559号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。すなわち前述のアシルチオセミカルバジド化合物(41)を、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤と反応させることによって、得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチ

ルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、アルキル化剤は(41)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-22)は、前述のチオセミカルバジド化合物(39)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナト

リウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(39)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(39)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-23)は、イソチオシアネート化合物(7)と式(42)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(43)へ変換した後、さらに必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(16)で表されるケトン化合物と反応させることによって得られる。イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(43)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトニトリル等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(42)は(7)に

対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。チオセミカルバジド化合物(43)から本発明化合物(1-23)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、クロロホルム、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(43)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(43)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-24)は前述のチオセミカルバジド化合物(43)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等の

エーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(43)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(19)は(43)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-25)はヘテロサイクルス(Heterocycles)第50巻、195頁(1999年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(44)で表されるメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、ジチオカルバミン酸エステル化合物(45)とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アルキル化剤で処理することにより、ジチオアセタール化合物(2-1)へと変換できる。さらにジチオアセタール化合物(2-1)と式(46)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより(2-2)および(1-

25)の混合物が得られる。また、(7)から(2-1)の反応では、(45)を単離することなく(2-1)を得ることもできる。また、(2-1)から(1-25)の反応では、長時間あるいは、加熱することにより(2-2)を単離することなく(1-25)を得ることもできる。また、単離した(2-2)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させるかまたは加熱処理することにより、(1-25)へ変換することもできる。

(7)から(2-1)への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビスクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、

1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、(45)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(44)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。またアルキル化剤は(45)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(2-1)から(1-25)への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、キシレン、トルエン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(2-1)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(46)は(2-1)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

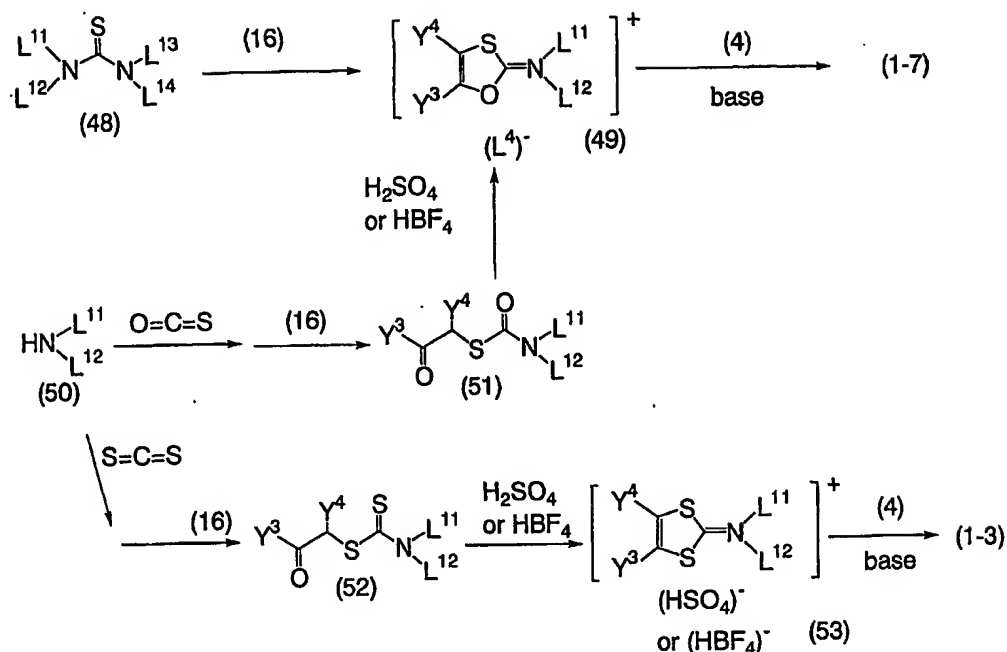
本発明化合物（１－２６）は、特開昭５５－１０８８６９およびケミストリー・レターズ（Chemistry Letters）１７０５頁（１９８８年）記載の方法あるいはその方法に準じて、製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物（７）と式（４７）で表されるアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによって、チオウレア化合物（４８）へ変換できる。さらに、チオウレア化合物（４８）は、式（１６）で表されるケトン化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによりプソイドチオウレア化合物（２－３）へと変換できる、さらに（２－３）は、必要に応じて溶媒中、塩基で処理することにより遊離の化合物（２－４）に変換できる。さらに、（２－４）は、必要に応じて溶媒中、酸で処理することにより、本発明化合物（１－２６）に変換できる。また、チオウレア化合物（４８）とケトン類（１６）との反応で、塩基を過剰に用いることにより、（２－３）を単離することなく、（２－４）を得ることもできる。また、チオウレア化合物（４８）とケトン類（１６）との反応で、長時間あるいは、加熱処理することにより、（２－３）および（２－４）を単離することなく（１－２６）を得ることもできる。イソチオシアネート化合物（７）から、チオウレア化合物（４８）を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、１，２－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、１，２－ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ－Ｎ－ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、－８０℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、０℃から溶媒の沸点

の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(47)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。チオウレア化合物(48)から本発明化合物(1-26)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジオキサン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(48)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(48)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法2)

前記(1)のAがジチオレン環またはオキサチオレン環で表される本発明化合物(1-7)および(1-3)は、(製造法1)で示した方法のほか、以下に示

すような方法によっても合成できる。



(L^4 、 Y^3 および Y^4 は前述と同じ意味を表す。(4)、(16)、(1-7)および(1-3)は前述と同じものを表す。 L^{11} 、 L^{12} 、 L^{13} および L^{14} は、各々独立に、 C_1 – C_4 アルキルを表すかまたは、 L^{11} と L^{12} または L^{13} と L^{14} とが一緒になって、ピペラジン環、モルホリン環、ピロリジン環、イミダゾール環、ピラゾール環またはピペリジン環を表す。)

すなわち、テトラアルキルチオウレア(48)とケトン化合物(16)とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、反応させることによりオキサチオレンイミニウム塩(49)とすることが出来る。さらに、得られた(49)をアミノ化合物(4)と反応させることにより、本発明化合物(1-7)を得ることが出来る。

テトラアルキルチオウレア(48)からオキサチオレンイミニウム塩(49)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチ

ル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(16)は(48)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。オキサチオレンイミニウム塩(49)から本発明化合物(1-7)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当

量としては、塩基は(49)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(4)は(49)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、オキサチオレンイミニウム塩(49)は、アミン化合物(50)を硫化カルボニルおよびケトン化合物(16)で順次処理することにより、チオカーバメート化合物(51)とした後、濃硫酸またはテトラフルオロホウ酸にて脱水することにより得ることもできる。

アミン化合物(50)からチオカーバメート化合物(51)を経てオキサチオレンイミニウム塩(52)を得る反応は、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第20巻、304頁(1972年)に記載の方法あるいはその方法に準じて行うことができる。

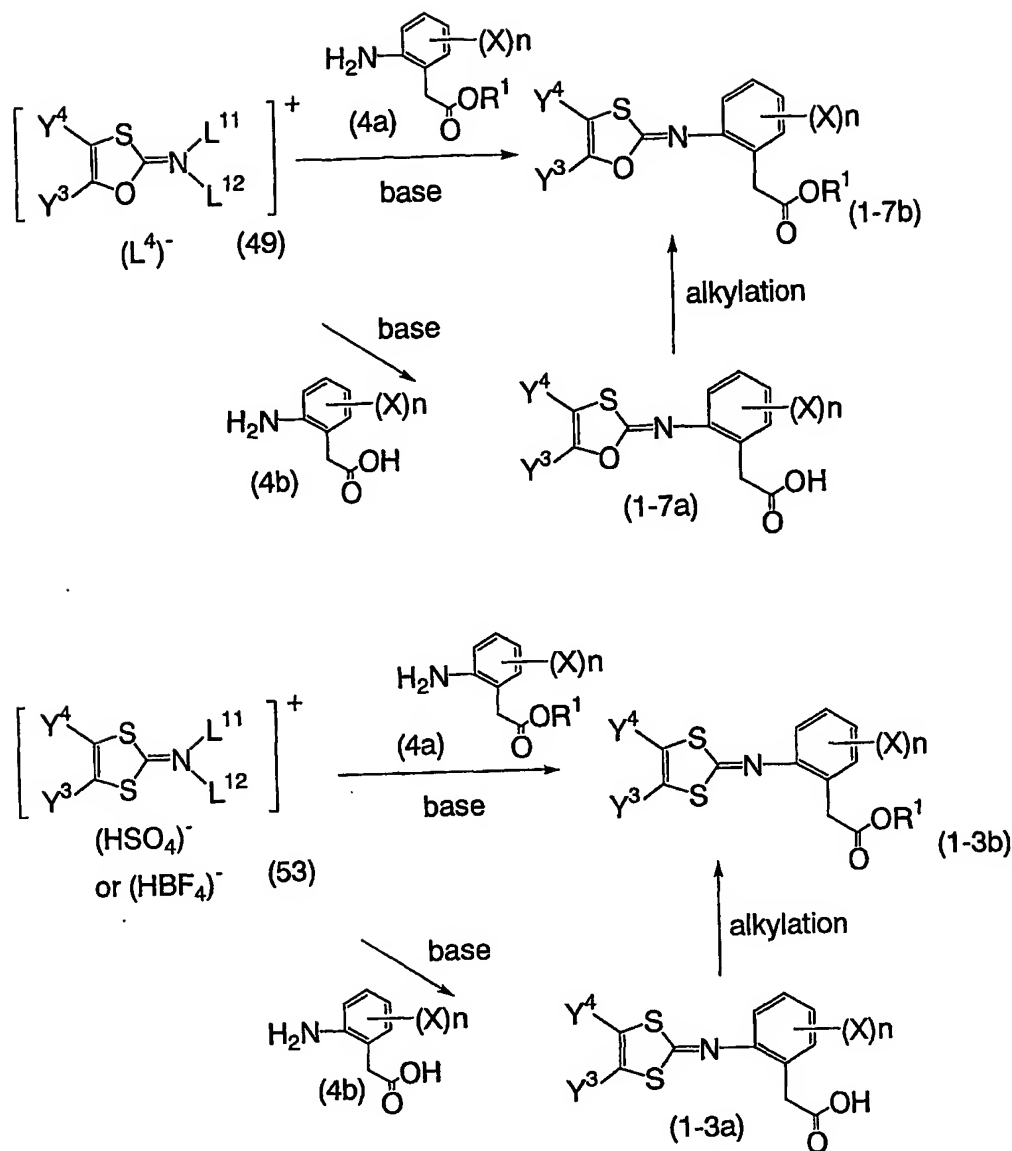
また、本発明化合物(1-3)は、アミン化合物(50)を二硫化炭素およびケトン化合物(16)で順次処理することにより、ジチオカーバメート化合物(52)とした後、濃硫酸またはテトラフルオロホウ酸にて脱水することにより、ジチオレンイミニウム塩(53)とすることが出来る。さらに、得られた(53)をアミノ化合物(4)と反応させることにより、本発明化合物(1-3)を得ることが出来る。

アミン化合物(50)からジチオカーバメート化合物(52)を経てジチオレンイミニウム塩(53)を得る反応は、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第17巻、1924頁(1969年)、テトラヘドロン・レターズ(Tetrahedron Letters)1137頁(1971年)およびケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第20巻、1711頁(1972年)に記載の方法あるいはその方法に準じて行うことができる。ジチオレンイミニウム塩(53)から本発明化合物(1-3)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、

1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、塩基は(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(4)は(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法3)

また、前記(1)のAがジチオレン環またはオキサチオレン環であり、かつGが $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OR}^1$ で表される本発明化合物は、(製造法1)で示した方法のほか、以下に示すような方法によっても合成できる。



(X、n、R¹、Y³、Y⁴、L⁴、L¹¹およびL¹²は前述と同じ意味を表す。

)

すなわち、本発明化合物(1-7b)は、(製造法2)により得られたオキサチオレンイミニウム塩(49)をアミノフェニル酢酸エステル化合物(4a)と反応させることにより得ることが出来る。また、(49)とアミノフェニル酢酸(4b)とを反応させ、いったん、イミノフェニル酢酸化合物(1-7a)とした後、エステル化することによっても得ることができる。

また、本発明化合物（１－３ｂ）は、上記の方法により得られたジチオレンイミニウム塩（５３）をアミノフェニル酢酸エステル化合物（４ａ）と反応させることにより得ることが出来る。また、（５３）とアミノフェニル酢酸（４ｂ）とを反応させ、いったん、イミノフェニル酢酸化合物（１－３ａ）とした後、エステル化することによっても得ることができる。

オキサチオレンイミニウム塩（４９）とアミノフェニル酢酸エステル化合物（４ａ）とから本発明化合物（１－７ｂ）を得る反応、オキサチオレンイミニウム塩（４９）とアミノフェニル酢酸化合物（４ｂ）とからイミノフェニル酢酸化合物（１－７ａ）を得る反応、ジチオレンイミニウム塩（５３）とアミノフェニル酢酸エステル化合物（４ａ）とから本発明化合物（１－３ｂ）を得る反応およびジチオレンイミニウム塩（５３）とアミノフェニル酢酸化合物（４ｂ）とからイミノフェニル酢酸化合物（１－７ａ）を得る反応においては、それぞれ溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、１，２－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ－メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、１，２－ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、Ｎ－メチルピペリジン、４－ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、－８０℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、０℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、５分から１００時間の範囲で行うことができ、１時間から４８時間の範囲が好ましい。塩基の当量

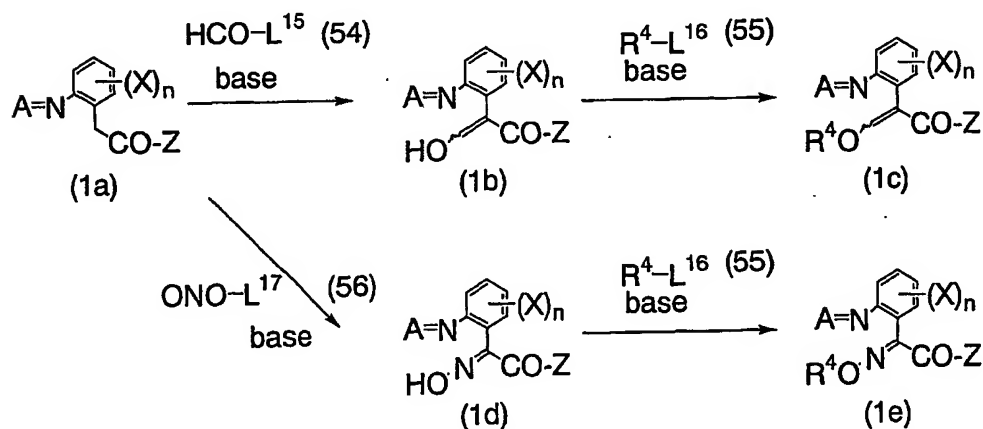
としては、塩基は(49)または(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(4a)はそれぞれ(49)および(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また(4b)はそれぞれ(49)および(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1-7a)から(1-7b)を得る反応および(1-3a)から(1-3b)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、メチルブロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキシニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキシニウム塩等が挙げられ、好ましくは、ジメチル硫酸またはヨウ化メチル等が挙げられる。また、アルコール中脱水剤を用いて合成することも出来、脱水剤としては、濃硫酸、アザジカルボン酸ジエチル、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、トルエン、ベンゼン、キシレン等の溶媒を用いて、共沸脱水により反応させることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行う

ことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法4)

前記(1)のGが $-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ および $-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ で表される本発明化合物は、(製造法1)および(製造法2)に示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法3)により得られた本発明化合物(1-1)から(1-26)、(1-3b)および(1-7b)に相当する(1a)で表されるヘテロイミノフェニル酢酸化合物を出発原料として、以下に示すような方法で製造することもできる。



(A, X, n, R^4 , Zは、前述と同じ意味を表す。L¹⁵は良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルコキシ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミ

ノ、炭素数 1～4 のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。L¹⁶は良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数 1～4 のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシ等である。L¹⁷は、炭素数 1～6 のアルキルまたは、ナトリウム、カリウム等の無機塩を表す。)

すなわち、本発明化合物 (1 a) は、式 (5 4) で表されるギ酸ハライド化合物、ギ酸エステル化合物またはギ酸アミド化合物と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより本発明化合物 (1 b) に変換できる。さらに (1 b) は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式 (5 5) で表されるアルキルハライドまたはアルキル硫酸エステル等と反応させることにより、本発明化合物 (1 c) に変換できる。また、(1 a) から (1 b) への反応では、塩基を過剰に用いて、(1 b) を単離せずに直接 (1 c) を合成することもできる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うこ

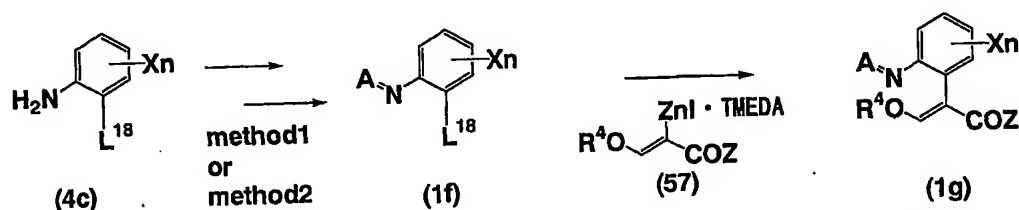
とができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1a)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(54)は(1a)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、本発明化合物(1a)は、式(56)で表される亜硝酸エステル化合物または亜硝酸塩類と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより本発明化合物(1d)に変換できる。さらに(1d)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(55)で表されるアルキルハライドまたはアルキル硫酸エステル等と反応させることにより、本発明化合物(1e)に変換できる。また、(1a)から(1e)への反応では、塩基を過剰に用いて、(1d)を単離せずに直接(1e)を合成することもできる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点

の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1a)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(56)は(1a)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法5)

前記(1)のGが $-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ で表される本発明化合物は、(製造法1)、(製造法2)および(製造法4)で示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法2)における(4)の代わりに、アニリン化合物(4c)を出発原料として上記合成法と同様に本発明化合物(1-1)ないし(1-26)に相当するヘテロ環イミノフェニル化合物(1f)を合成した後、以下に示すような方法で製造することもできる。



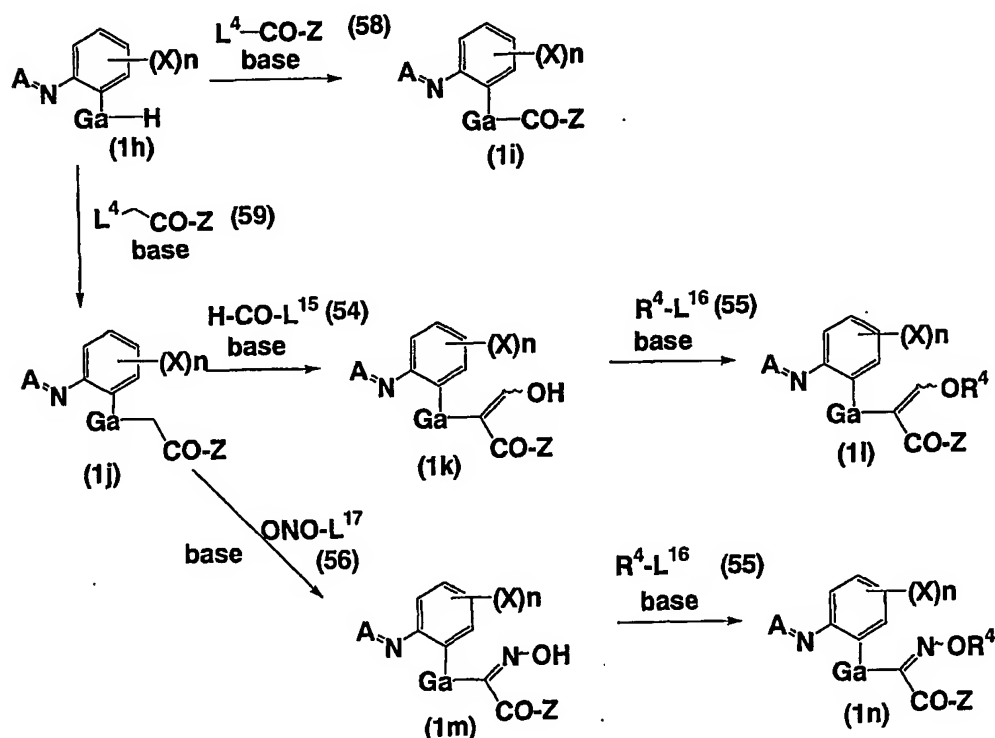
(A, X, n, Z, R⁴は前述と同じ意味を表す。L¹⁸は、良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1～4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシなどを表す。)

すなわち、テトラヘドロン (Tetrahedron) 第54巻、7595頁(1998年)記載の方法あるいは、その方法に準じて(1f)とアクリル酸亜鉛錯体(57)とを反応させることにより合成することが出来る。

(製造法6)

また、Gが $-N(OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-N(R^4)-C(=O)Z$ 、 $-O-C(=O)Z$ 、 $-S-C(=O)Z$ 、 $-N(OR^4)-CH_2-C(=O)Z$ 、

$-N(R^4)-CH_2-C(=O)Z$ 、 $-O-CH_2-C(=O)Z$ 、 $-S-CH_2-$
 $-C(=O)Z$ 、 $-N(OR^4)-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-N(R^4)-$
 $-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-O-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-S-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-N(OR^4)-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-N(R^4)-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-O-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ または $-S-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ で表される本発明化合物は、(製造法1)および(製造法2)において示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法2)におけるニトロ化合物(4)のGの代わりに、Ga-H (Gaは-O-, -NH-, -N(R⁴)-, -S-および-N(OR⁴)-を表す。)を有する化合物を出発原料とし、上記合成法と同様に(1-1)ないし(1-26)に相当するヘテロ環イミノフェニル化合物(1h)を合成した後、以下のように合成することもできる。すなわち、



(A、X、n、L⁴、L¹⁵、L¹⁶、L¹⁷、R⁴およびZは、前述と同じ意味を表し

、Gaは、 $-O-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-N(OR^4)-$ 、 $-S-$ または $-CH_2-N(R^4)-$ を表す。)

すなわち本発明化合物(1i)は、式(1h)で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物等を溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物(58)と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1h)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(58)は(1h)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、本発明化合物(1j)は、式(59)で表されるハロ酢酸化合物等と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ヘテロ環イミノフェニル化合物(1h)と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であ

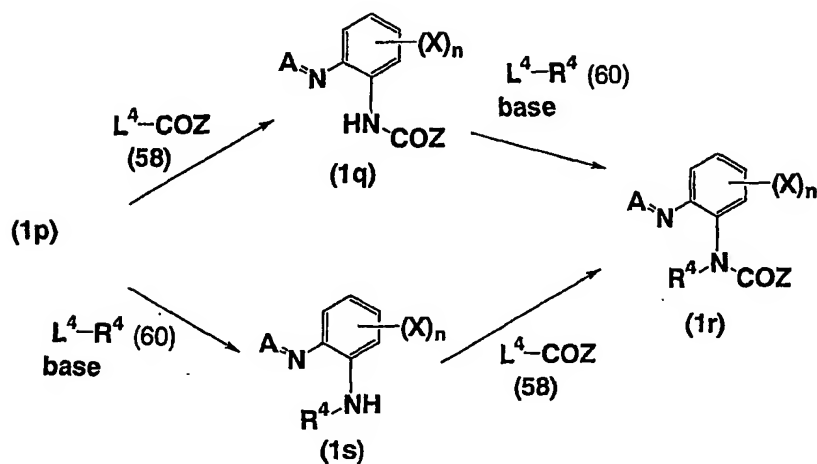
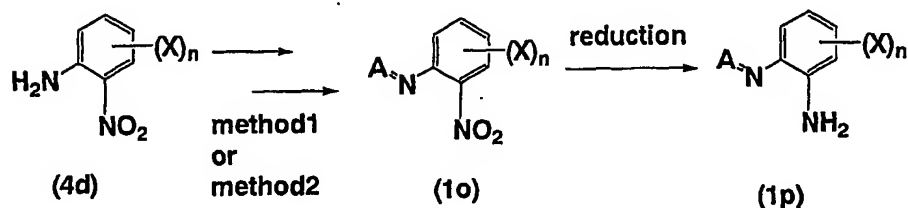
ればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1 h)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(59)は(1 h)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1 j)から本発明化合物(1 k)を経て本発明化合物(1 l)を得る反応および本発明化合物(1 j)から本発明化合物(1 m)を経て本発明化合物(1 n)を得る反応は、(製造法4)に示した(1 a)から(1 c)および(1 e)をそれぞれ得る方法と同様に実施出来る。

(製造法7)

前記(1)のGが $-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{N}(\text{OR}^4)\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^4)\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ および $-\text{N}(\text{OR}^4)\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、で表される本発明化合物は、(製造法1)、(製造法2)および(製造法6)に示した方

法のほかに、（製造法 1）および（製造法 2）における（4）の G の代わりに、ニトロ基を有するアニリン化合物（4 d）を出発原料として得られたヘテロイミノベンゼン化合物（1 o）から、以下に示すような方法で製造することもできる。



（A, X, n, Z, L⁴, R⁴は前述と同じ意味をあらわす。）

すなわち、ヘテロ環イミノニトロベンゼン化合物（1 o）は必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ニトロ基を還元することにより、ヘテロ環イミノアニリン化合物（1 p）とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物（58）と反応させることにより、本発明化合物（1 q）を得ることが出来る。さらに（1 q）は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式（60）で表されるアルキルはライドまたはアルキル硫酸エステル等と反応させることによって、本発明化合物（1 r）へと変換すること

が出来る。本発明化合物（1 r）はまた、（1 p）をまず（6 0）と反応させた後、カルボニル化合物（5 8）と反応させることによって得ることが出来る。

（1 o）から（1 p）を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、蟻酸、プロピオン酸等の有機酸類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。還元剤としては、例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化ジイソブチルアルミニウム等の水素化アルミニウム類、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素カリウム等の水素化ホウ素類、鉄、亜鉛、銅等の金属類、水素ガス等が挙げられる。触媒としては、塩化銅、塩化パラジウム、パラジウム/活性炭、白金/活性炭等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、（1 o）に対して、0.05から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、還元剤の当量としては、還元剤は（1 o）に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

（1 p）から（1 q）を得る反応および（1 s）から（1 r）を得る反応にお

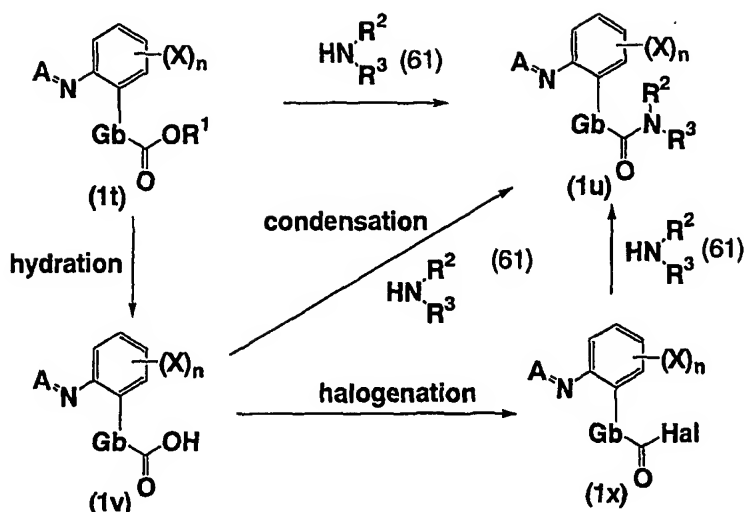
いては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1 p) または (1 s) に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(58) は (1 p) または (1 S) に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、(1 q) から (1 r) を得る反応および (1 p) から (1 s) を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピ

ロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1 q) または (1 p) に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(60) は (1 q) または (1 p) に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法8)

前記(1)のGが $-\text{B}-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_2\text{R}_3$ および $-\text{B}'-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_2\text{R}_3$ で表される本発明化合物は、(製造法1)から(製造法6)で示した方法のほかに、(製造法1)から(製造法6)において出発物質として、Zが OR^1 で表される化合物を用いて得られた本発明化合物(1-1)から(1-26)、(1-3b)、(1-7b)、(1a)から(1e)、(1i)から(1n)、(1q)および(1r)を用いて、以下に示すような方法によっても得ることが出来る。



(G bはBまたはB'を表し、A, X, n, Hal, R¹, R²およびR³は前述と同じ意味を表す。)

すなわち、式(1 t)で表される化合物を必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物(6 1)と反応させることにより、(1 u)とすることが出来る。また(1 u)は、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、必要に応じて酸または塩基存在下、(1 t)を加水分解することによって、(1 v)とした後、必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物(6 1)と脱水縮合させることによっても得ることが出来る。また、(1 v)を必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化し、酸ハライド化合物(1 x)とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物(6 1)と反応させることによっても(1 u)を得ることが出来る。

(1 t)から(1 u)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリ

ル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、メタノール、エタノールまたは水あるいはメタノールおよび水の混合溶媒等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から500時間の範囲で行うことができ、1時間から100時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(61)は(1 t)に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1 t) から (1 v) を得る反応においては、溶媒としては反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミドまたは水あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられる。また、水を溶媒として用いることも出来る。塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。酸としては、塩酸、硫酸等の無機酸や酢酸等の有機酸を用いることが出来る。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から200時間の範囲で行うことができ、1時間から500時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、水は(1 t)に対して、0.

5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。塩基および酸の当量としては、(1 t)に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1 v) から (1 u) を得る反応においては、溶媒は反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。縮合剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1, 1'-カルボニルジイミダゾール、アゾジカルボン酸ジエチルトリフェニルホスフィン、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド等が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド、ジメチルアミノピリジン等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から200時間の範囲で行うことができ、1時間から50時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(61) は (1 v) に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1 v) から (1 x) を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメ

チルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、N, N-ジメチルホルムアミドやテトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、オキシ塩化リン、塩化スルフリル、塩化チオニル、シュウ酸ジクロライド、塩素ガス、五塩化リン、三塩化リン、臭素、N-ブロモこはく酸イミド、N-クロロこはく酸イミド、テトラブチルアンモニウムトリブロマイド、三臭化リン、オキシ臭化リン等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、ハロゲン化剤は(1 v)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、(1 x)から(1 u)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。また、塩基および触媒を用いずに、溶媒中

で加熱することによっても (1 u) を得ることができる。反応温度は、 -80°C から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、 0°C から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(61)は(1 x)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、塩基の等量としては、(1 x)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法1)における出発物質である式(3)で表されるニトロ化合物は、公知の方法で製造できる。

例えば、Gが $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ で表されるニトロフェニル酢酸化合物は、ヨーロッパ特許出願公報(EP-570817号公報)、シンセシス(Synthesis) 51頁(1993年)、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J. Org. Chem.) 第61巻、5994頁(1996年)等に記載の公知の方法で製造できる。

また、Gが $-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{N}(\text{OR}^4)\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^4)\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ および $-\text{N}(\text{OR}^4)\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ で表されるニトロアニリン化合物は、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プリパレーションズ(Organic Functional Group Preparations) (Academic Press) 第2巻、第10章~第12章(1971年)等に記載の公知の方法でオルトニトロアニリンまたはオルトハロニトロベンゼン等から製造できる。

また、Gが $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ 、 $-\text{S}-\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ および $-\text{S}-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Z}$ で表されるニトロフェノールおよびニトロチオフェノール化合物は、文献記載の公知の方法でオルトフェノールまたはオルトチオフェノールから製造できる。

また、Gが $-\text{CH}_2-\text{A}^2\text{a}$ で表される化合物は、ニトロフェニル酢酸を原料に、国際出願公開WO94/22844号公報および国際出願公開WO95/04728号公報に記載されている方法により製造することができる。

また、 B^2 が $-\text{C}(=\text{NOR}^4)-$ で A^2 が A^2a のものは、国際出願公開WO9

5/04728号公報に記載の方法によって製造することができる。

また、 A^2 が A^2a 、 A^2d 、 A^2f 、 A^2g 、 A^2h のとき、 B^2 が $-CH_2-$ 、 $-C(=CHOR^4)-$ または $-C(=NOR^4)-$ である化合物については、ニトロフェニル酢酸を原料に、国際出願公開WO94/22844号公報に記載されている方法により製造することができ、 B^2 が $-CH(CN)-$ 、 $-CH(C\equiv CH)-$ 、 $-CH(OR^4)-$ 、 $-N(OR^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(OR^4)CH_2-$ 、 $-N(R^4)CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-SCH_2-$ である化合物については、ニトロフェニル酢酸エステルのメチレン部分をそれぞれ B^2 に置き換えた化合物を出発原料にして同様に製造することができる。 A^2 が A^2b 、 A^2c 、 A^2d 、 A^2g 、 A^2i 、 A^2m 、 A^2n 、 A^2o 、 A^2p または A^2q のとき、 B^2 が $-C(=NOR^4)-$ である化合物は、国際出願公開WO95/26956号公報記載の方法で製造することができ、 B^2 が $-CH(CN)-$ 、 $-CH(C\equiv CH)-$ 、 $-CH(OR^4)-$ 、 $-N(OR^4)CH_2-$ 、 $-N(R^4)CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ または $-SCH_2-$ である化合物は、原料であるハライドあるいはシアノ化合物を適宜変えることで同様に製造することができる。 A^2 が置換されていてもよいピリジル、 A^2e 、 A^2j または A^2k で B^2 が $-CH(OR^4)-$ である化合物は、国際出願公開WO97/12863号公報に記載された方法により製造することができる。 A^2 が A^2a 、 A^2d 、 A^2e 、 A^2f 、 A^2g 、 A^2h 、 A^2i 、 A^2j 、 A^2k または l で B^2 が $-N(OR^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ の化合物については、例えば $-B^2-H$ が置換したニトロベンゼン化合物と A^2-L （但し、 L は良好な脱離基例えば、ハロゲン原子、メタンスルホニル基等を表す。）との反応か、または L （但し、 L は前記と同様の意味を表す。）が置換したニトロベンゼン化合物と A^2-B^2-H との反応により製造することができる。 A^2 が A^2l の化合物は国際出願公開WO96/17835号公報記載の方法で、 A^2 が A^2q の化合物は国際出願公開WO99/7687号公報記載の方法で、それぞれ製造することができる。

また、ニトロベンゼンのオルト位に G^2 、 G^5 、 G^6 または G^7 で表される基が置換した化合物は、例えば国際出願公開WO95/14009、国際出願公開WO96/26191、国際出願公開WO96/36615あるいは特開平9-10

4 6 7 6 号公報記載の方法を参考に、 G^3 または G^9 で表される基が置換した化合物は、例えばWO 99 / 2 0 6 1 5 記載の方法を参考に、 G^4 が置換した化合物は、例えば国際出願公開WO 9 6 / 3 6 2 2 9 記載の方法を参考に、 G^{10} が置換した化合物は、例えばドイツ特許1 9 7 5 6 1 1 5 記載の方法を参考に、 G^{11} 、 G^{12} または G^{14} が置換した化合物は、例えば特開平1 1 - 3 3 5 3 6 1 号公報記載の方法を参考に、 G^{13} が置換した化合物は、例えば特開平1 1 - 2 2 0 0 5 0 号公報、特開平7 - 1 7 9 4 5 0 号公報等記載の方法を参考に、それぞれ製造することができる。

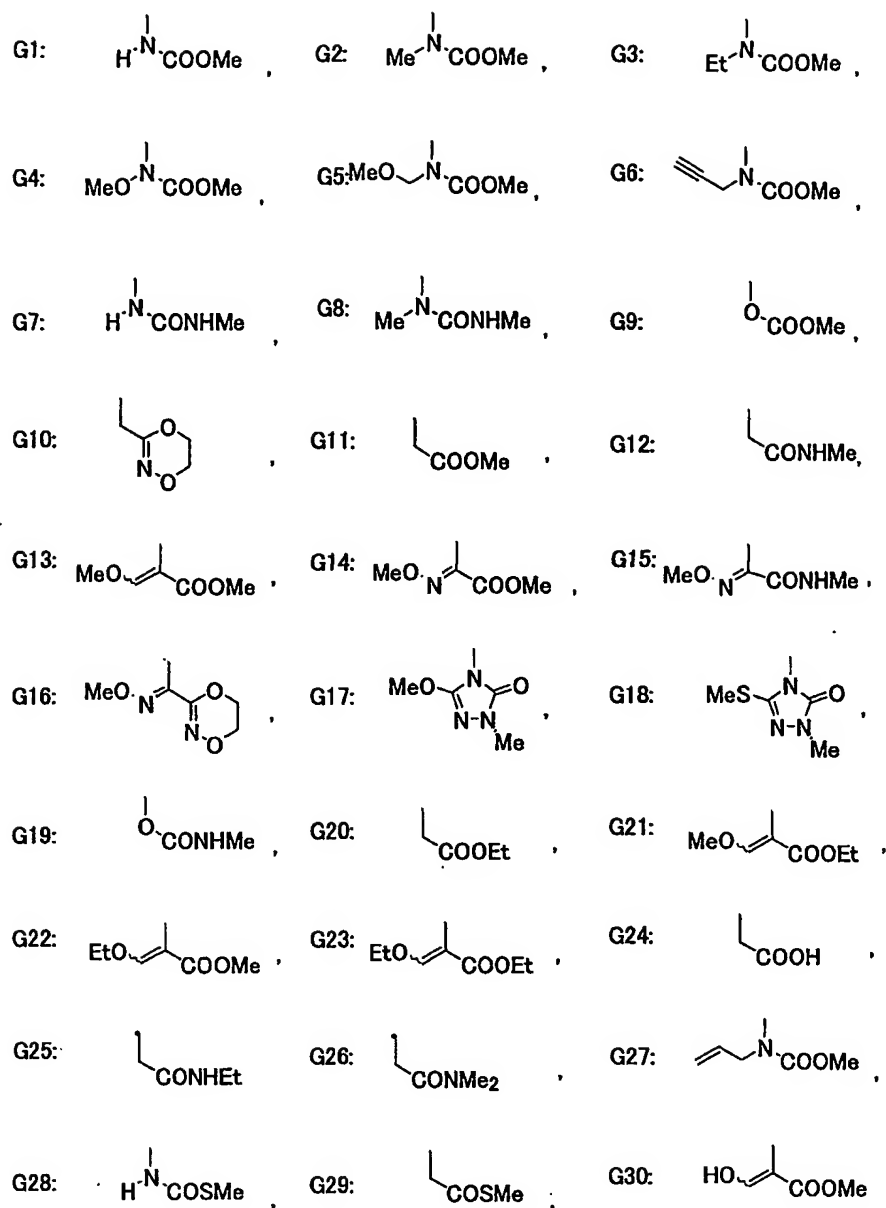
それぞれの工程で製造される本発明化合物またはその中間体は常法により反応液から得ることができるが、化合物を精製する必要がある場合には、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

次に、本発明に包含される化合物の例を第1表から第7表に示す。但し、本発明化合物は、これらのみに限定されるものではない。

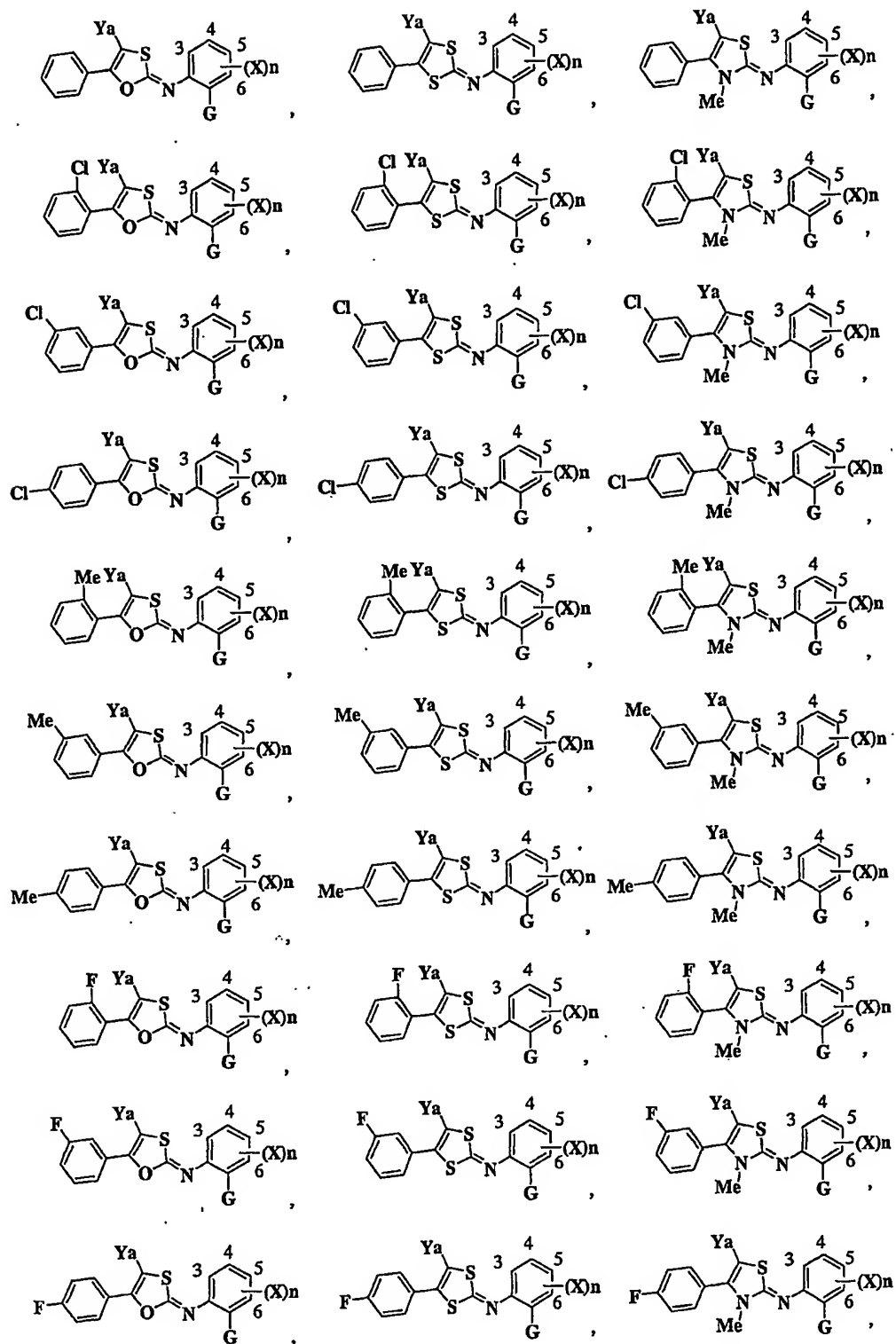
なお、表中の略号はそれぞれ以下の意味を示す。

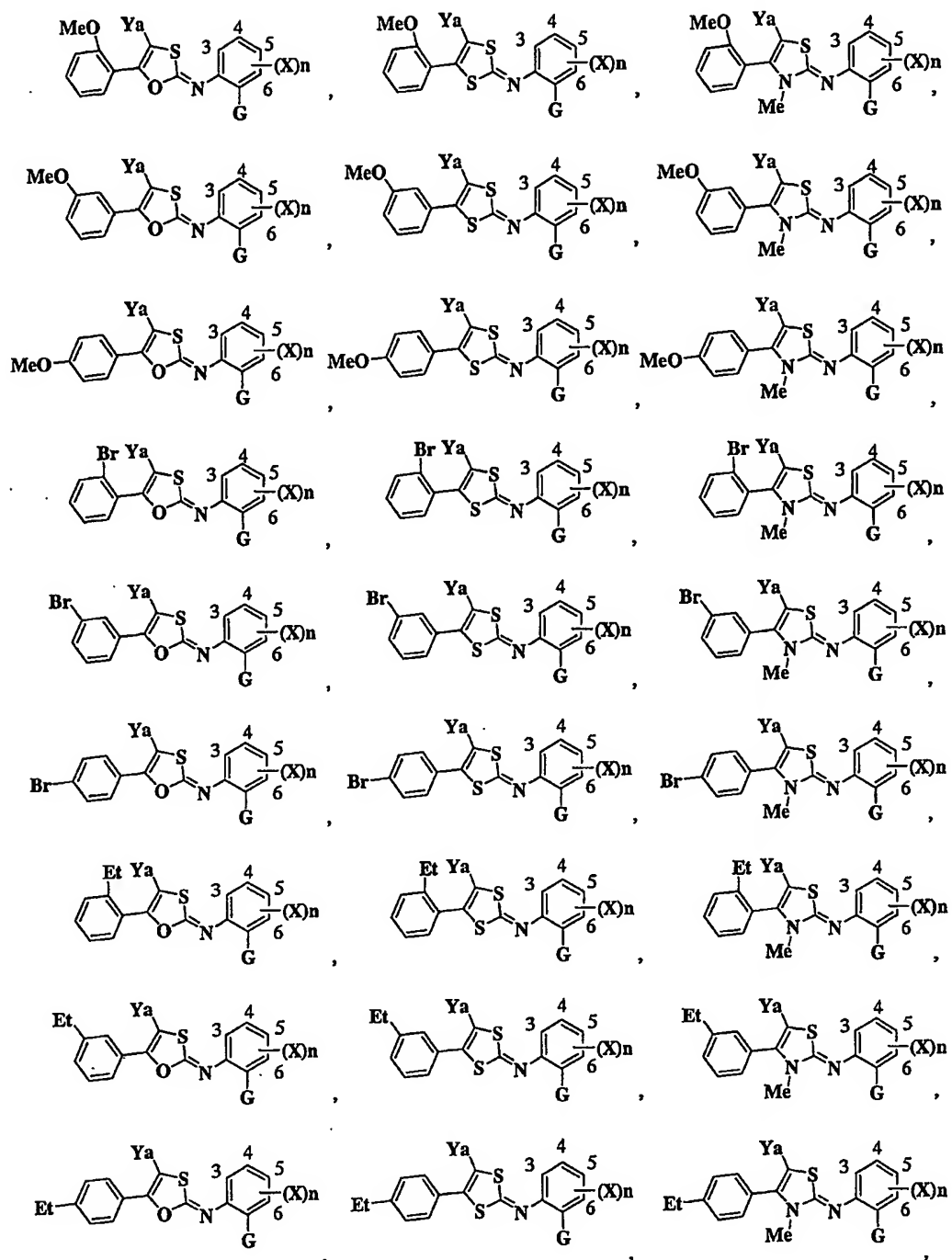
M e : メチル基、E t : エチル基、P r : プロピル基、B u : ブチル基、P e n : ペンチル基、H e x : ヘキシル基、P h : フェニル基、n : ノーマル、i : イソ、s : セカンダリー、t : ターシャリー、c : シクロ。

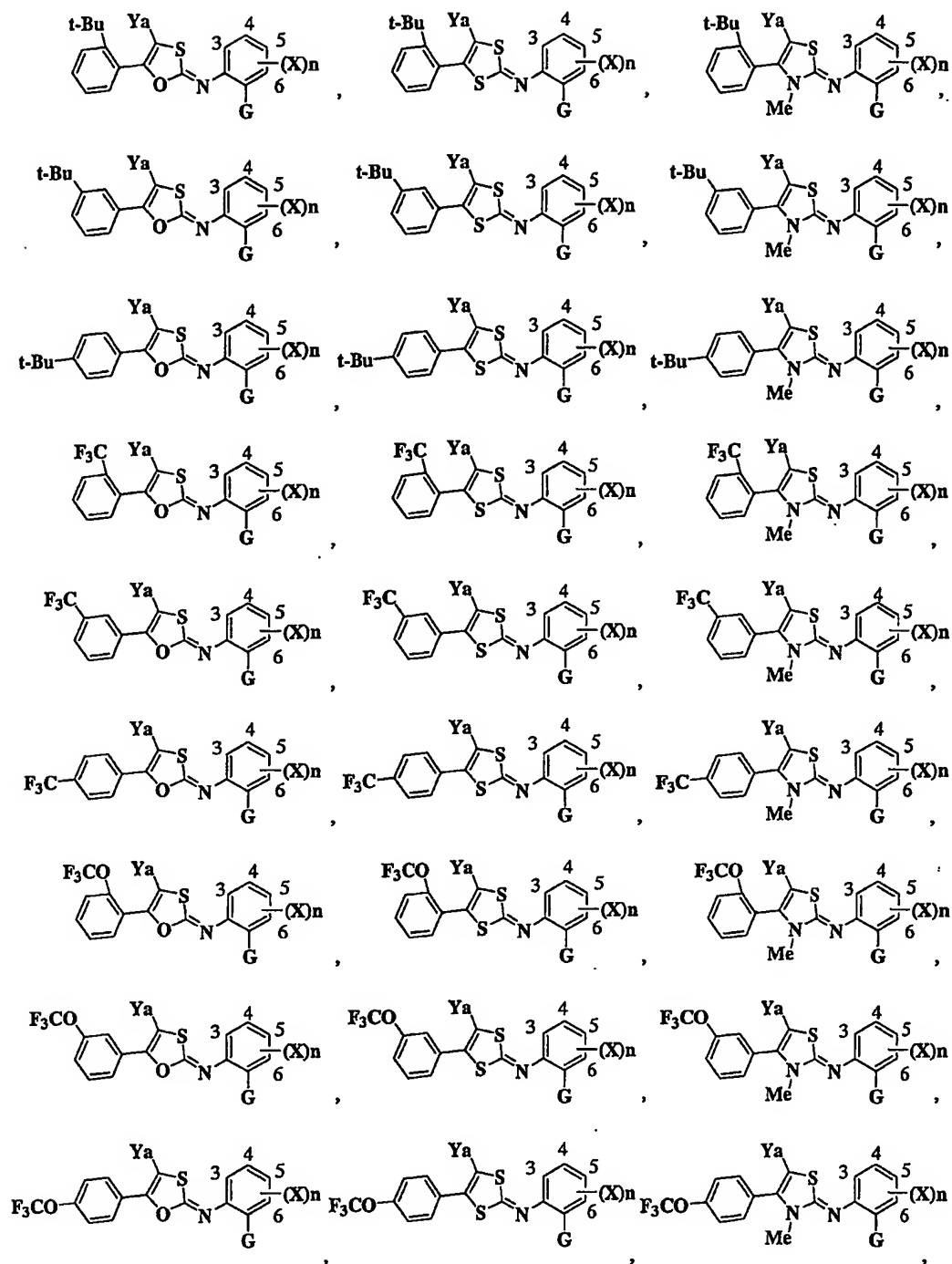
G1からG30は以下のものを表す。

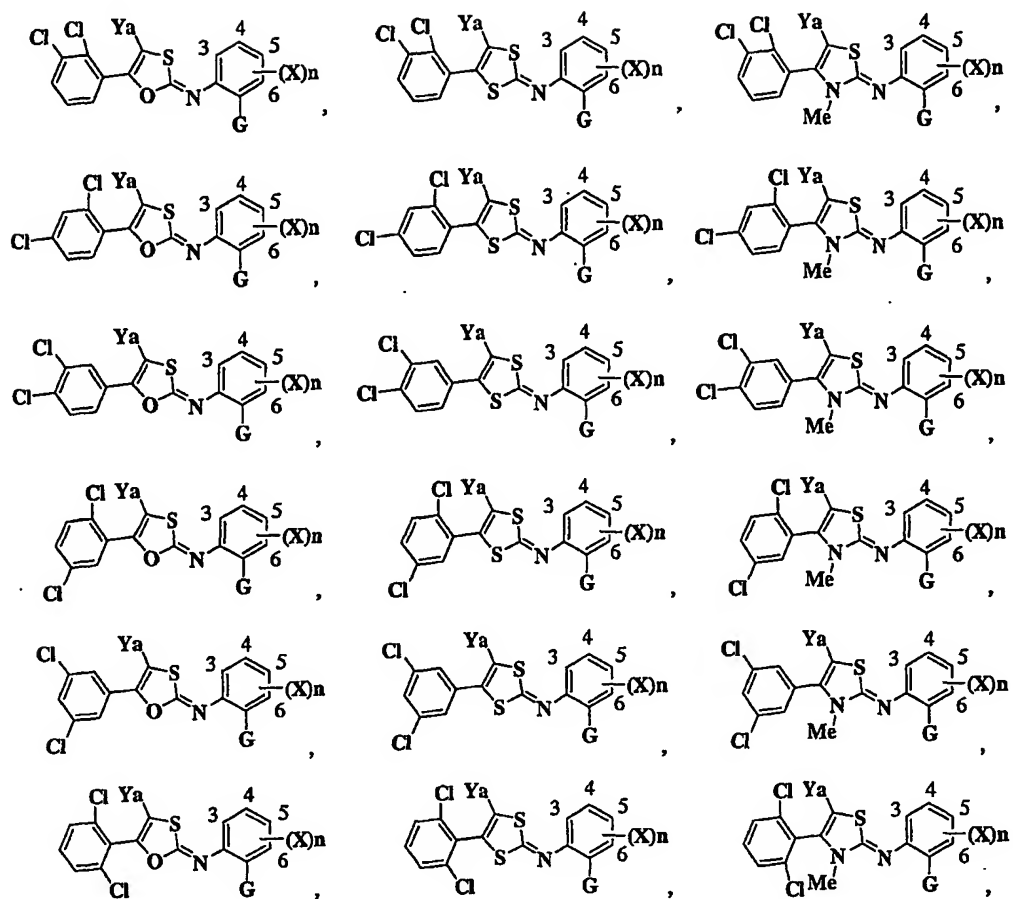


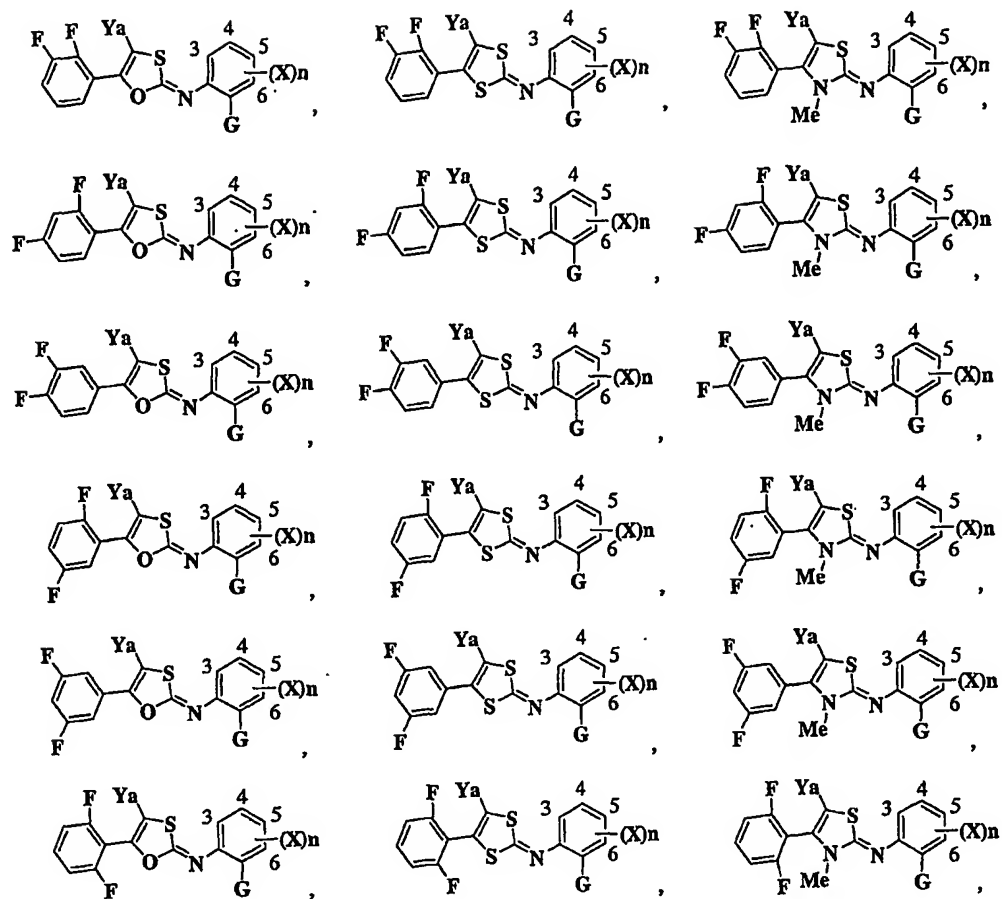
〔第 1 表〕

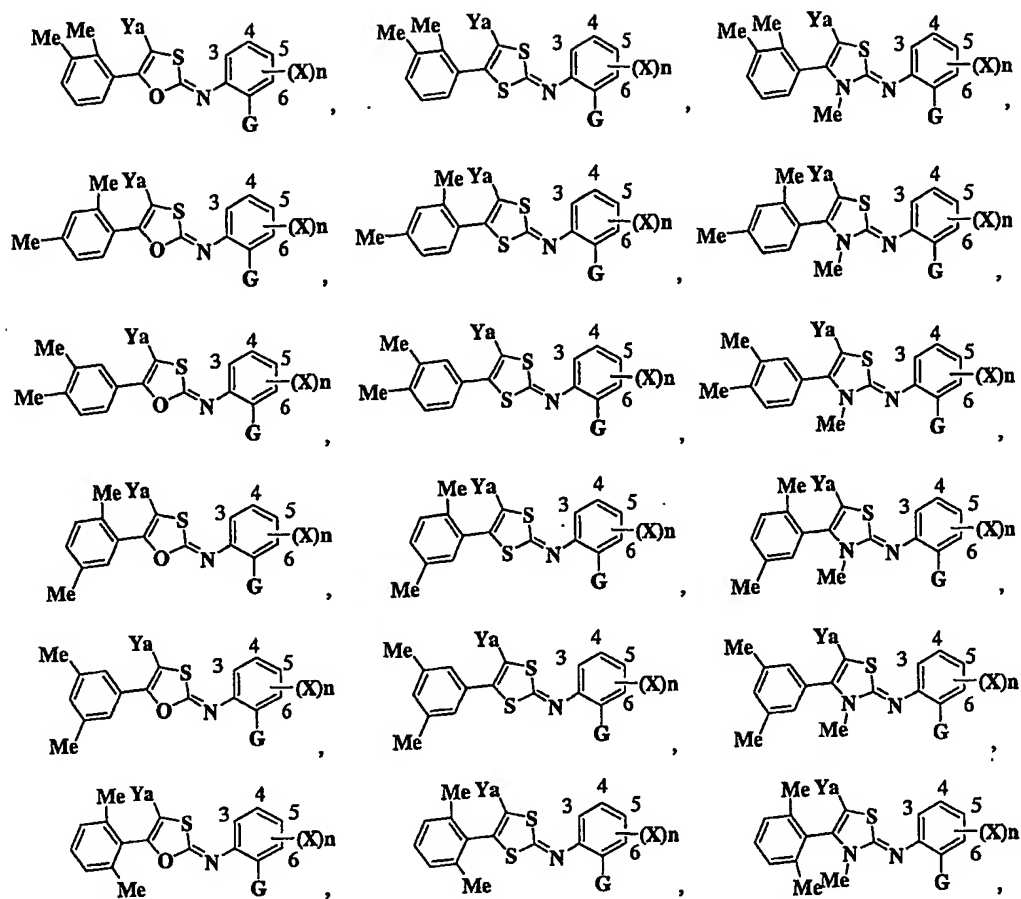


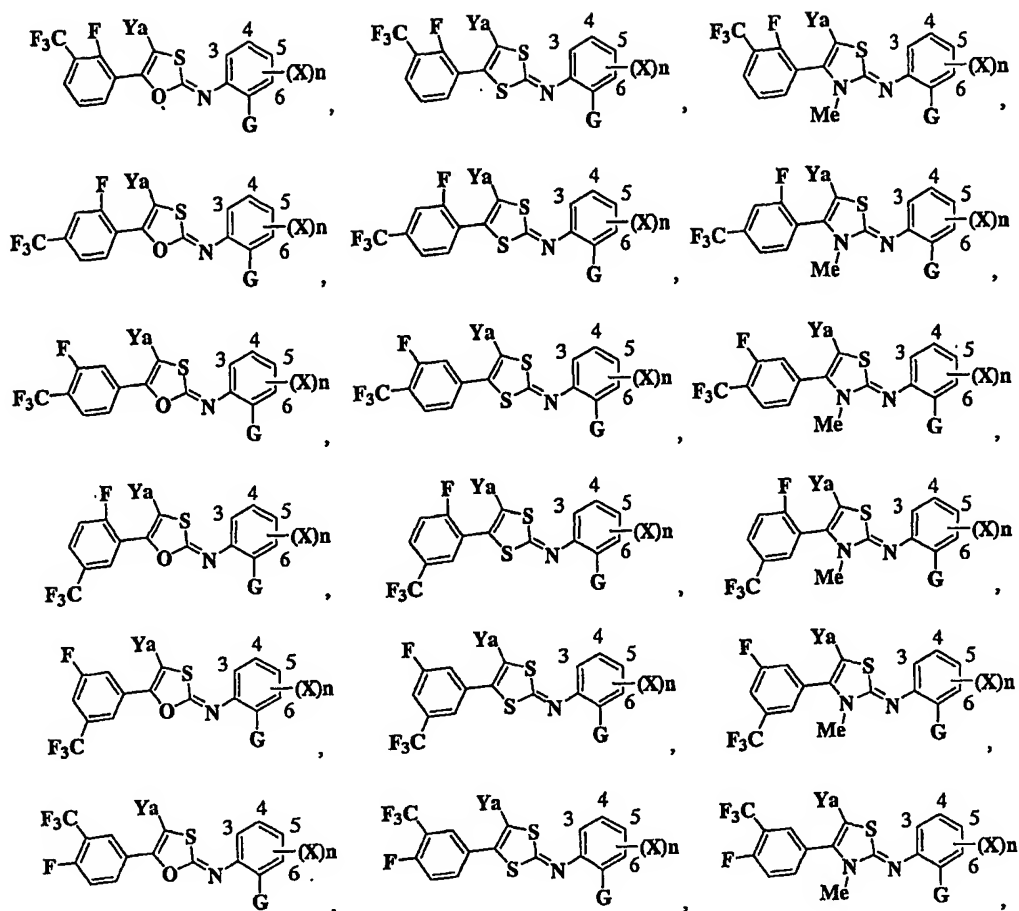


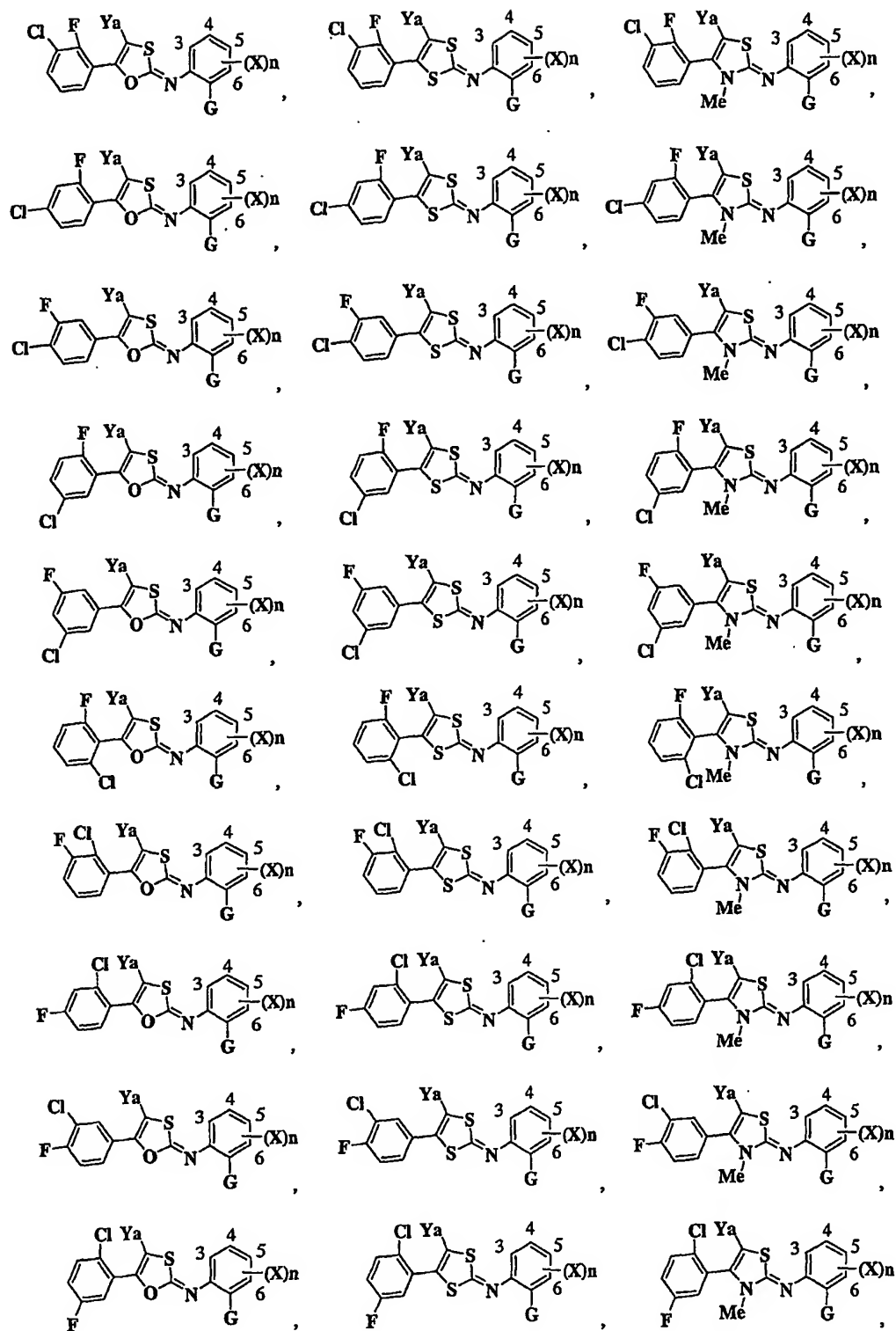


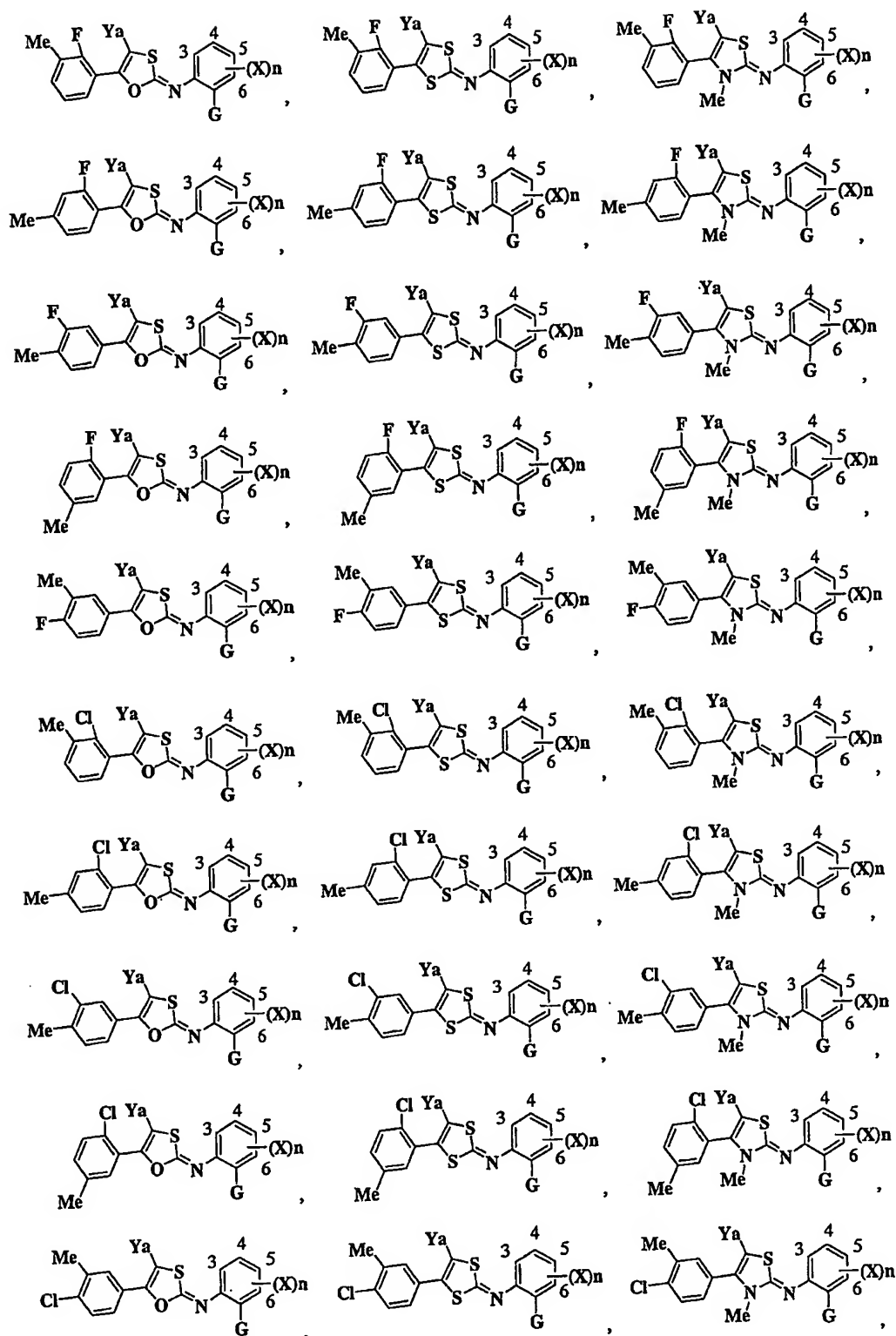


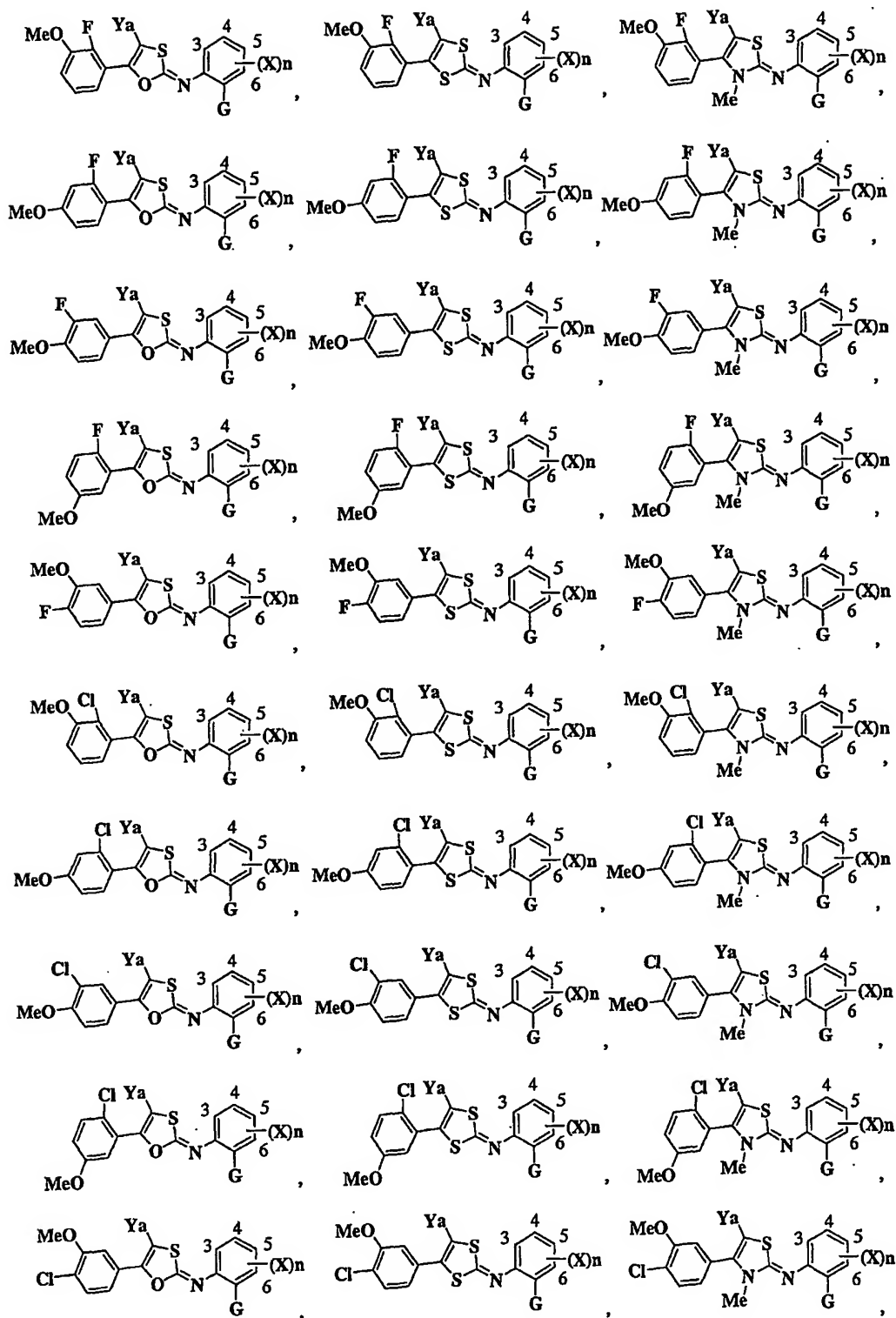


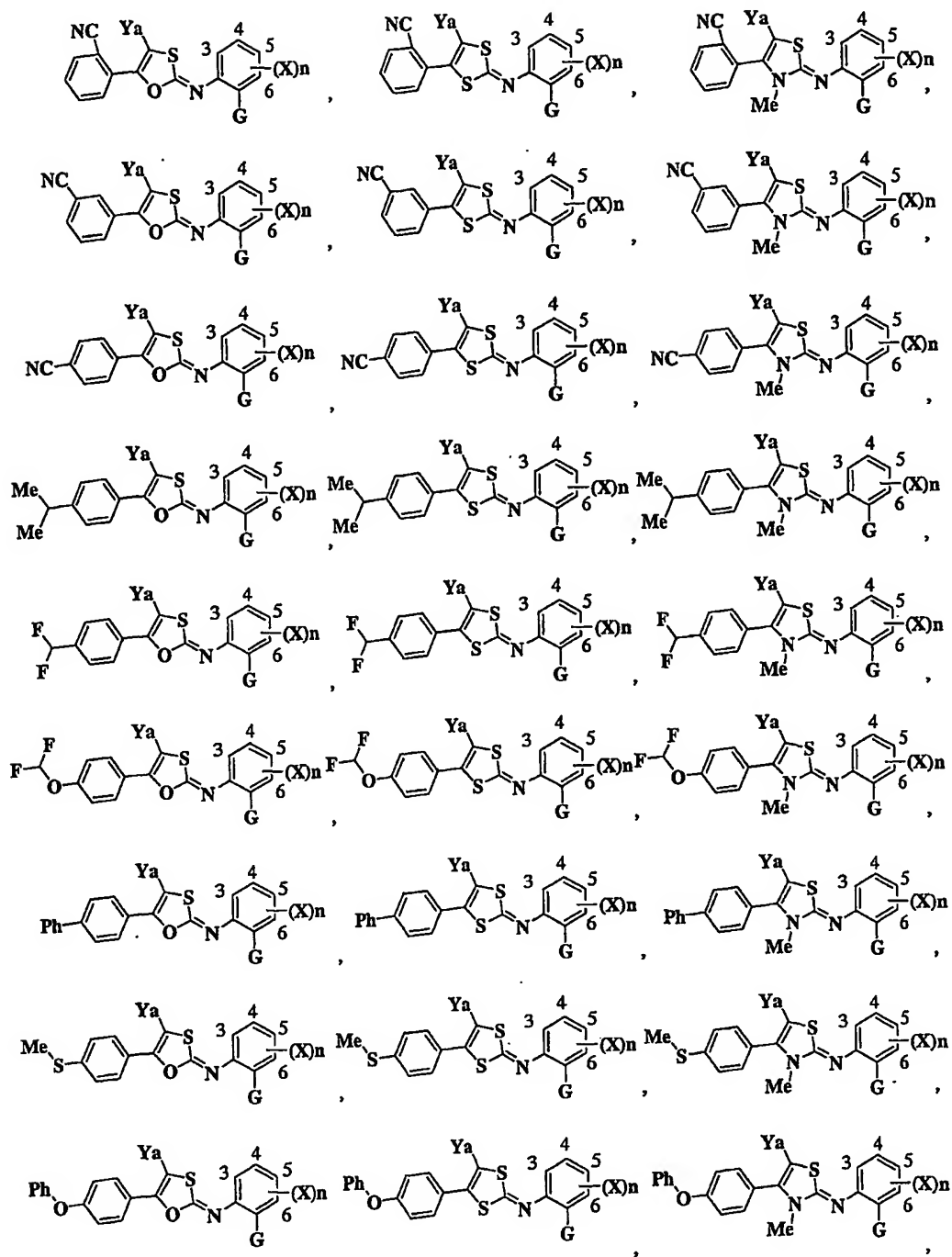


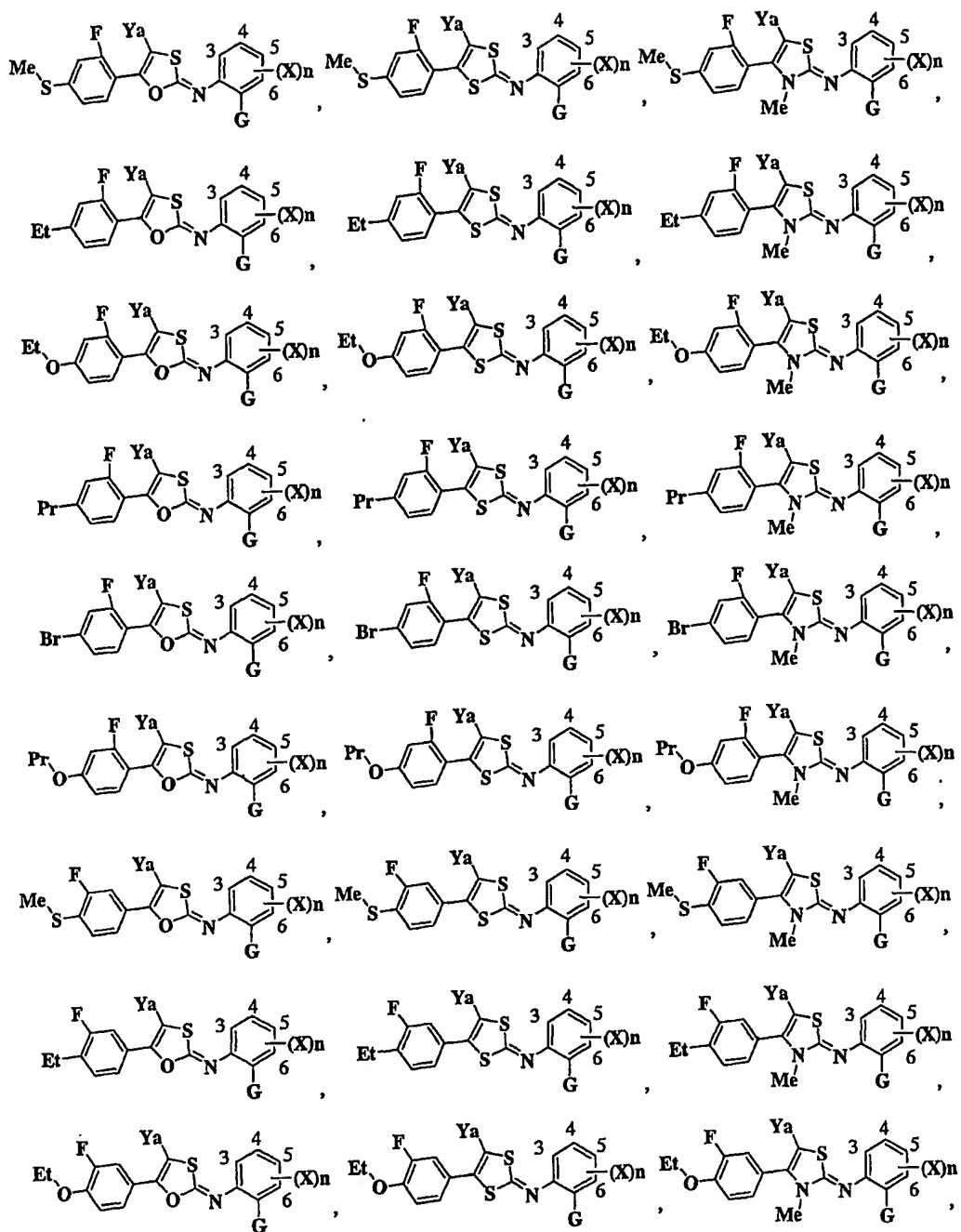


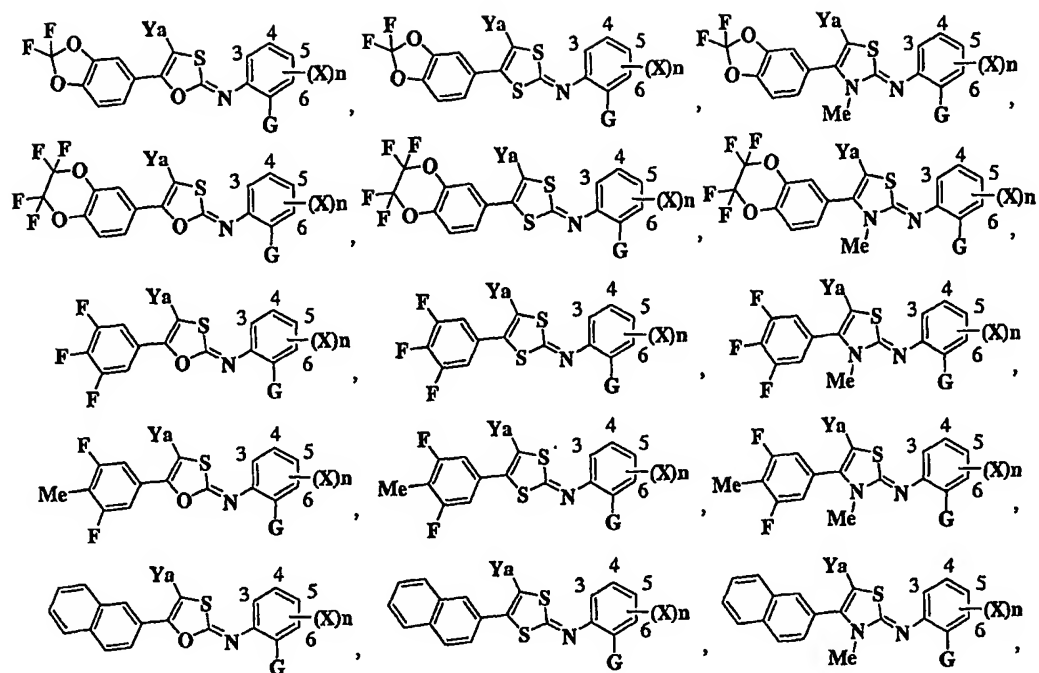


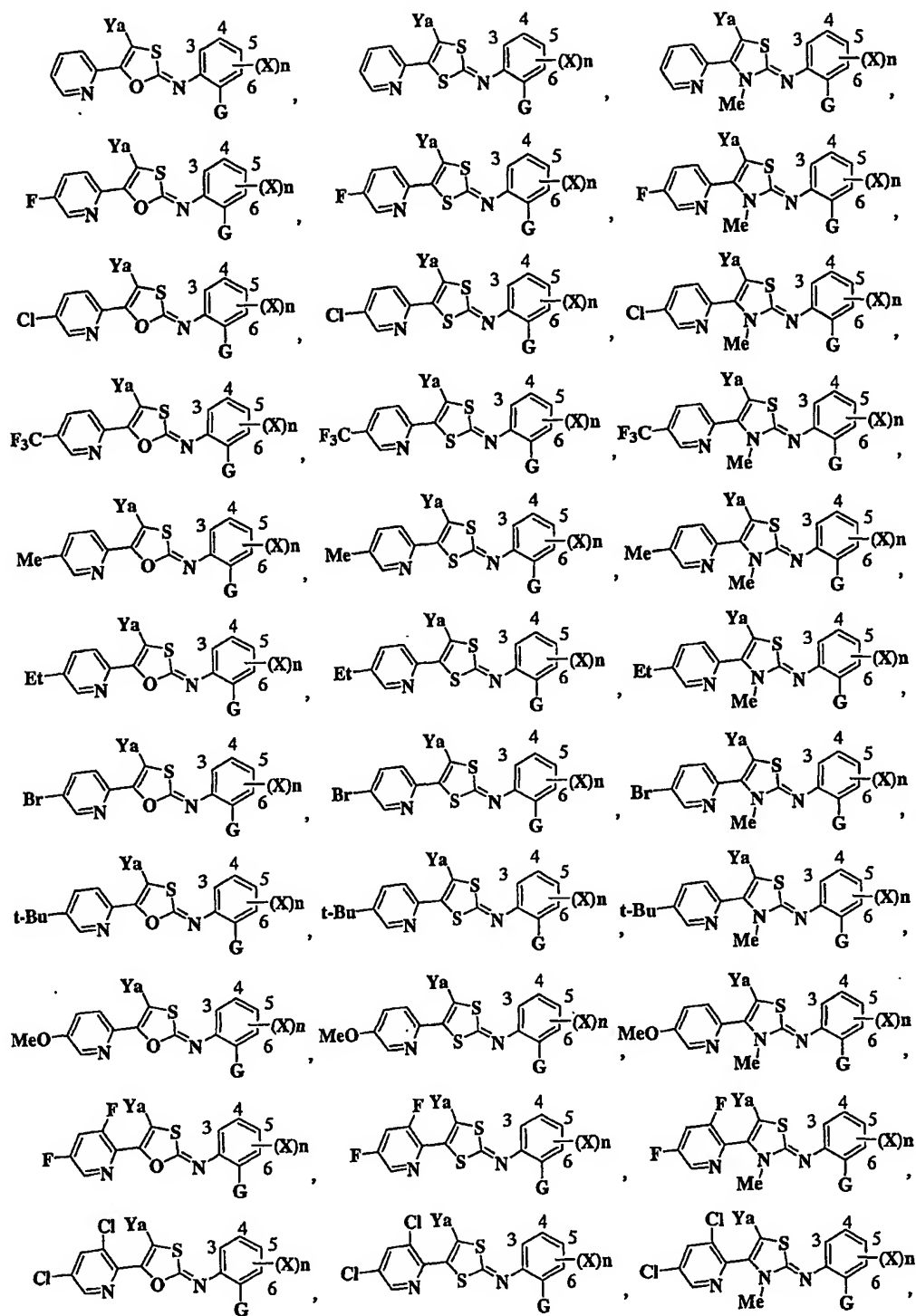


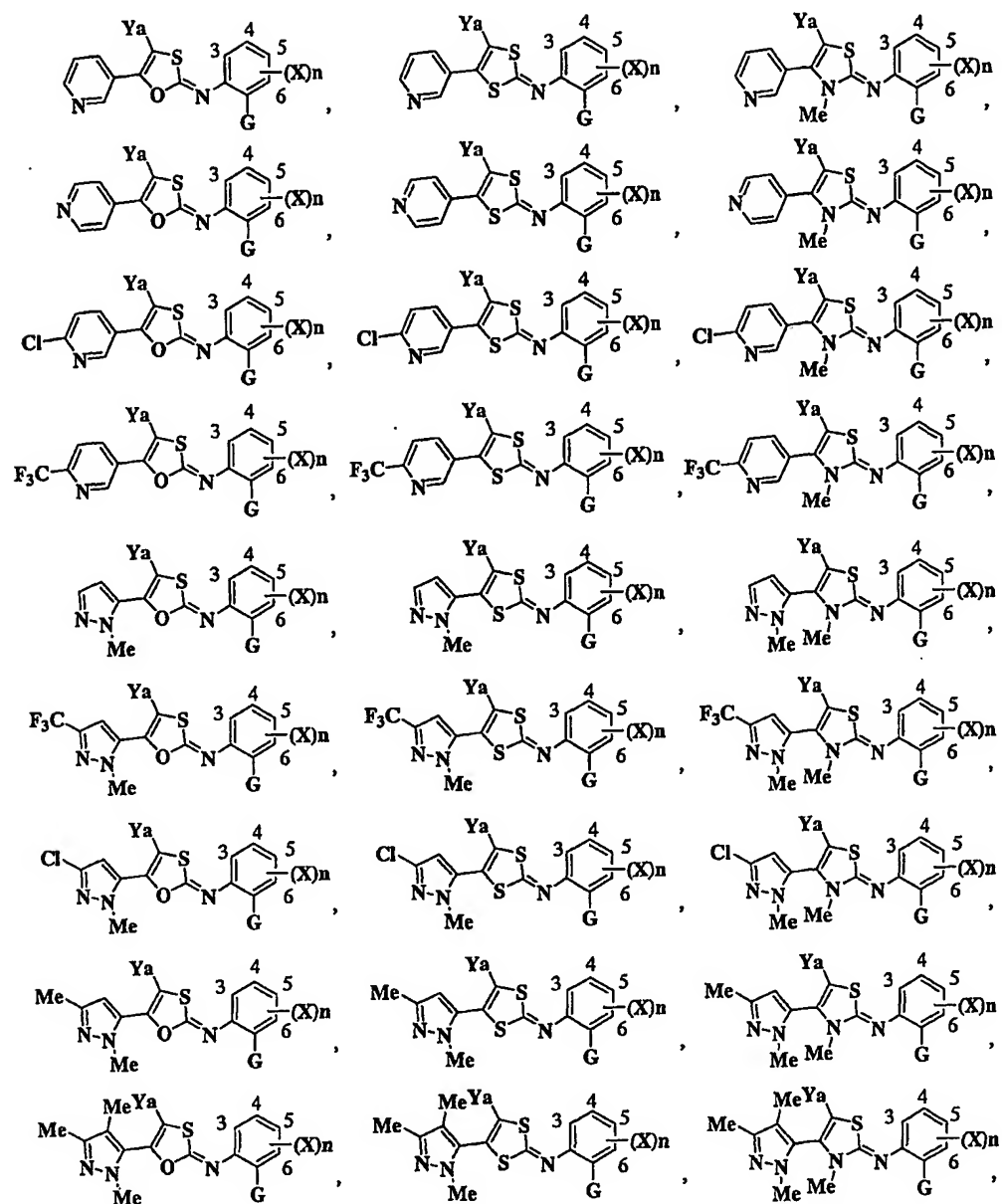


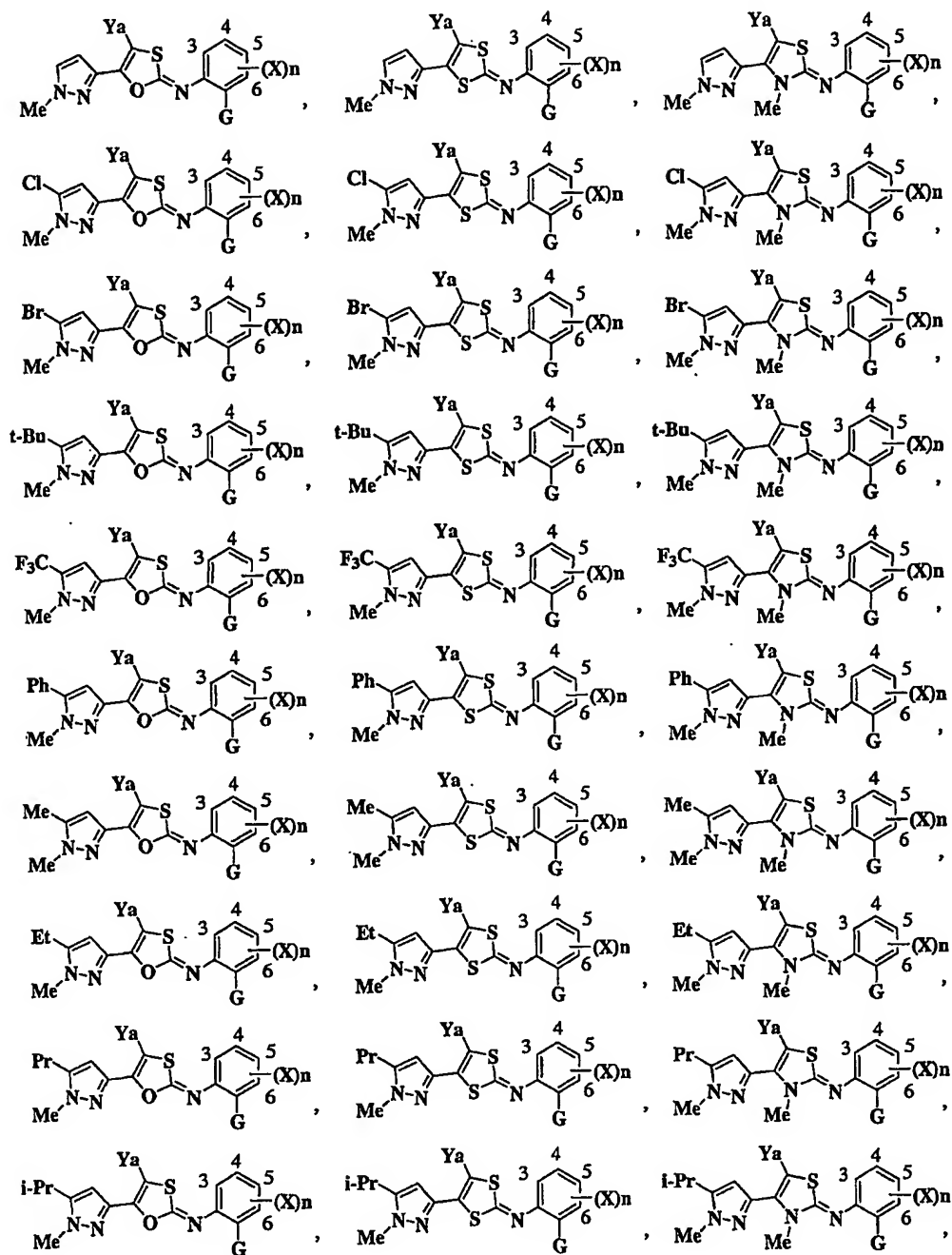


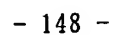


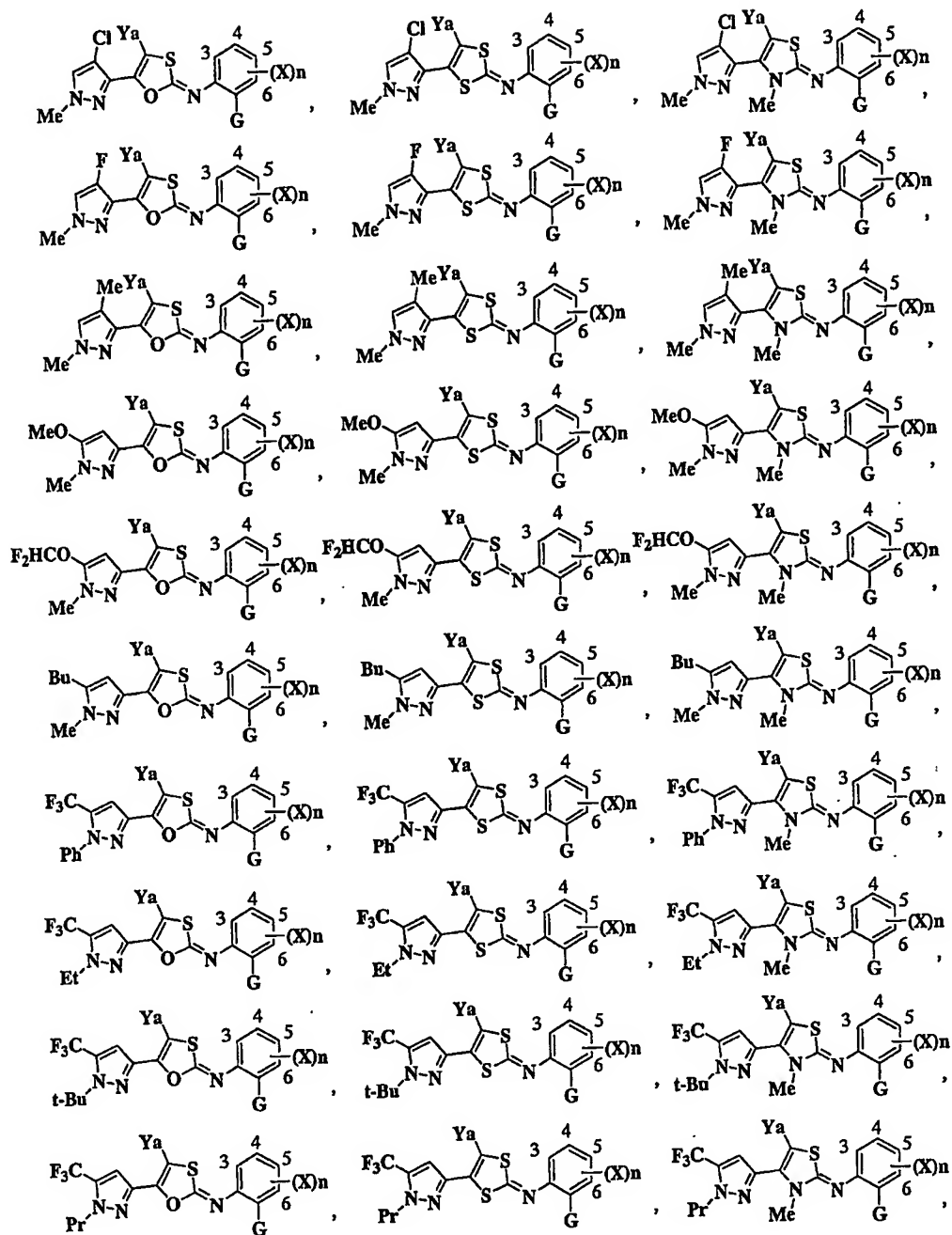


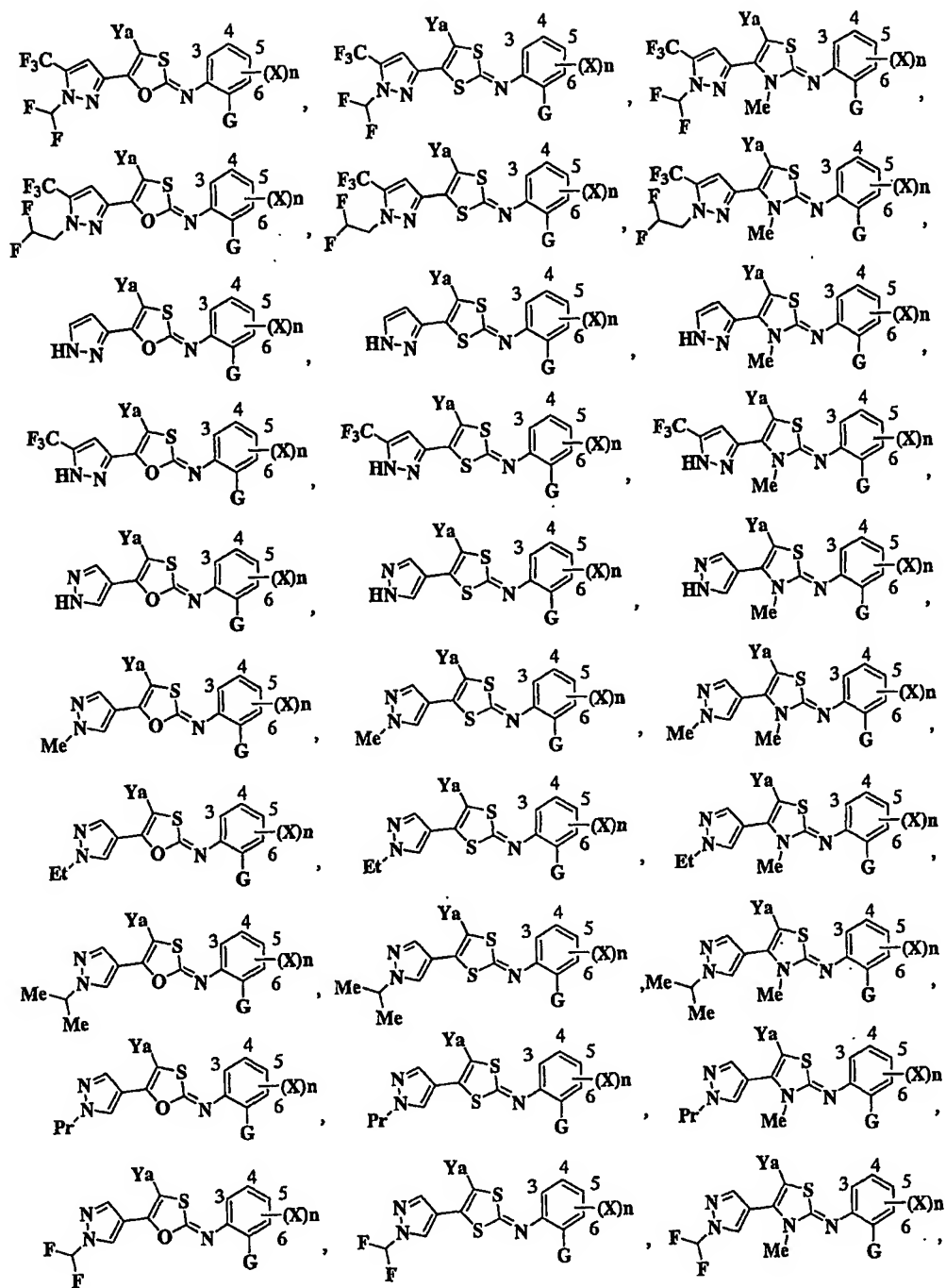


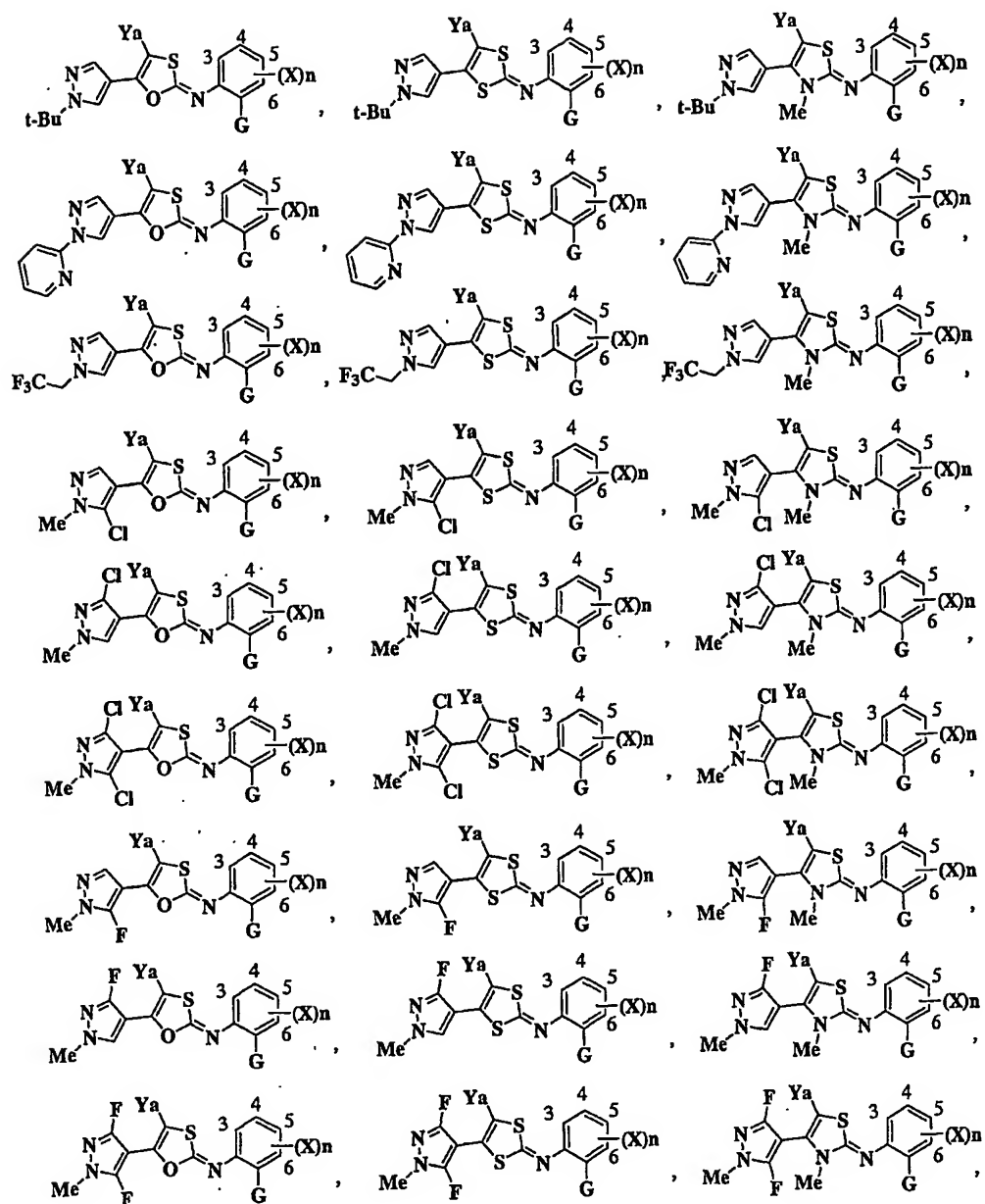


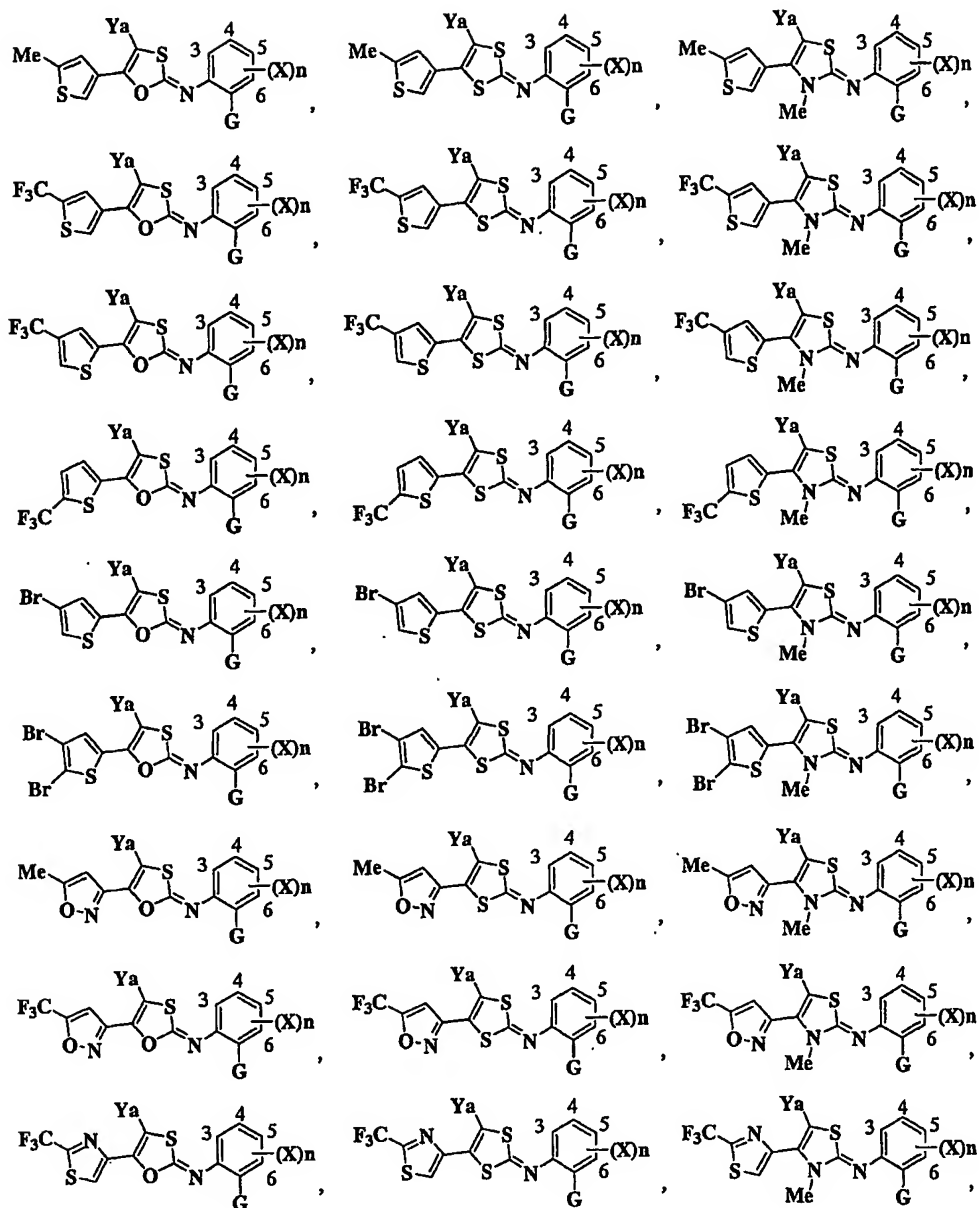


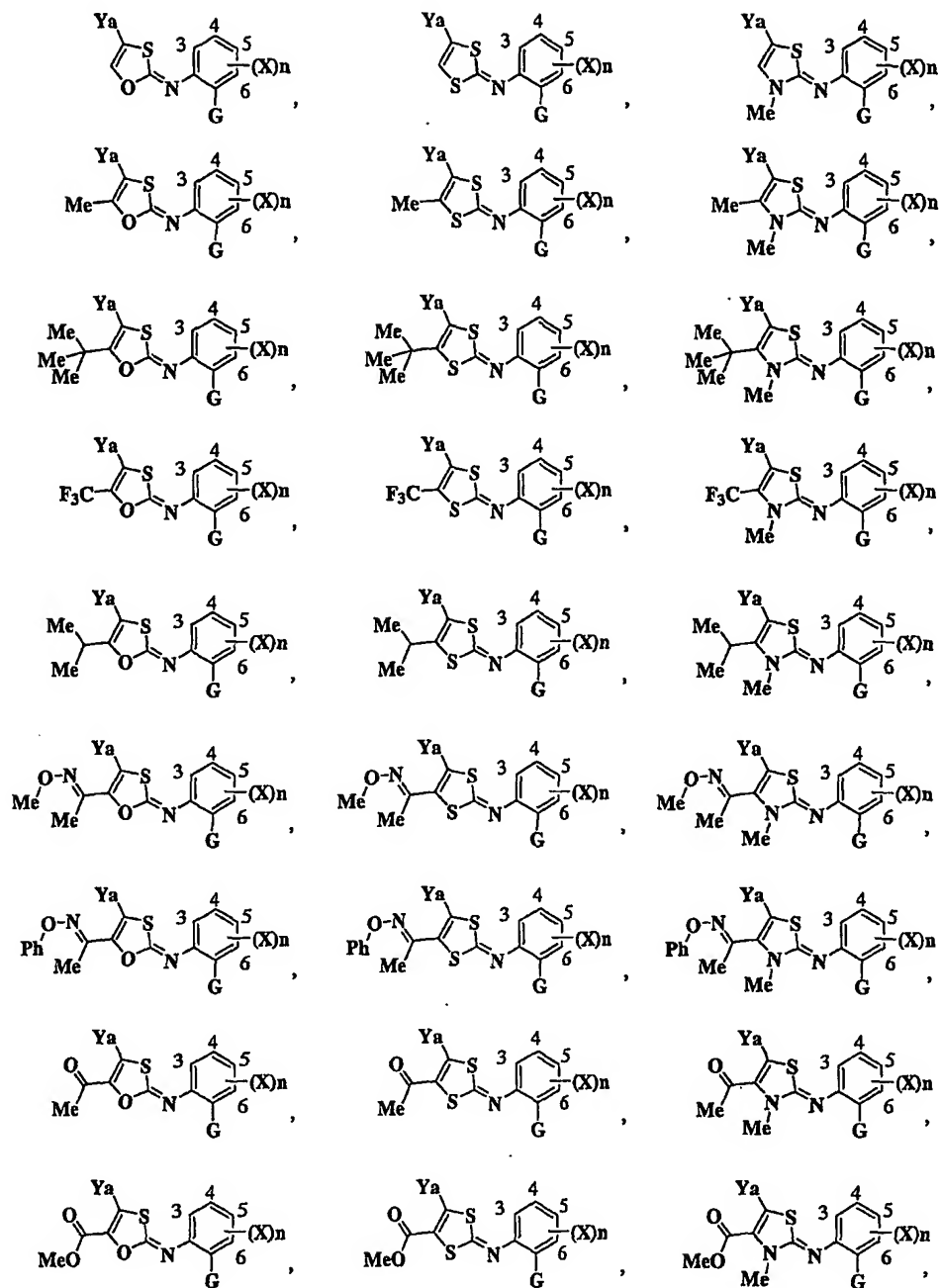












| Y a | X n | G |
|-----|------|----|
| H | H | G1 |
| H | 3-Me | G1 |
| H | 4-Me | G1 |
| H | 5-Me | G1 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| H | 6-Me | G1 |
| H | 4-Et | G1 |
| H | 4-t-Bu | G1 |
| H | 4-i-Pr | G1 |
| H | 4-CF ₃ | G1 |
| H | 4-OMe | G1 |
| H | 6-OMe | G1 |
| H | 4-OEt | G1 |
| H | 4-SMe | G1 |
| H | 4-NMe ₂ | G1 |
| H | 3-F | G1 |
| H | 4-F | G1 |
| H | 5-F | G1 |
| H | 6-F | G1 |
| H | 4-Cl | G1 |
| H | 6-Cl | G1 |
| H | 4-Br | G1 |
| H | 4-I | G1 |
| H | 4-CN | G1 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G1 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G1 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G1 |
| Me | H | G1 |
| Me | 3-Me | G1 |
| Me | 4-Me | G1 |
| Me | 5-Me | G1 |
| Me | 6-Me | G1 |
| Me | 3-Et | G1 |
| Me | 4-Et | G1 |
| Me | 5-Et | G1 |
| Me | 6-Et | G1 |
| Me | 4-t-Bu | G1 |
| Me | 4-i-Pr | G1 |
| Me | 3-CF ₃ | G1 |
| Me | 4-CF ₃ | G1 |
| Me | 5-CF ₃ | G1 |
| Me | 6-CF ₃ | G1 |
| Me | 3-OMe | G1 |
| Me | 4-OMe | G1 |
| Me | 5-OMe | G1 |
| Me | 6-OMe | G1 |
| Me | 3-OEt | G1 |
| Me | 4-OEt | G1 |
| Me | 5-OEt | G1 |
| Me | 6-OEt | G1 |
| Me | 3-SMe | G1 |
| Me | 4-SMe | G1 |
| Me | 5-SMe | G1 |
| Me | 6-SMe | G1 |
| Me | 3-NMe ₂ | G1 |
| Me | 4-NMe ₂ | G1 |
| Me | 5-NMe ₂ | G1 |
| Me | 6-NMe ₂ | G1 |
| Me | 3-F | G1 |
| Me | 4-F | G1 |
| Me | 5-F | G1 |
| Me | 6-F | G1 |
| Me | 3-Cl | G1 |

| | | |
|----|------------------------|----|
| Me | 4-Cl | G1 |
| Me | 5-Cl | G1 |
| Me | 6-Cl | G1 |
| Me | 3-Br | G1 |
| Me | 4-Br | G1 |
| Me | 5-Br | G1 |
| Me | 6-Br | G1 |
| Me | 3-I | G1 |
| Me | 4-I | G1 |
| Me | 5-I | G1 |
| Me | 6-I | G1 |
| Me | 3-CN | G1 |
| Me | 4-CN | G1 |
| Me | 5-CN | G1 |
| Me | 6-CN | G1 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G1 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G1 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G1 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G1 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G1 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G1 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G1 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G1 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G1 |
| Me | 3,4-F ₂ | G1 |
| Me | 3,5-F ₂ | G1 |
| Me | 3,6-F ₂ | G1 |
| Me | 4,5-F ₂ | G1 |
| Me | 4,6-F ₂ | G1 |
| Me | 5,6-F ₂ | G1 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G1 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G1 |
| Me | 4-Me-3-F | G1 |
| Me | 4-Me-5-F | G1 |
| Me | 4-Me-6-F | G1 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G1 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G1 |
| Me | 4-Me-6-Br | G1 |
| Me | 4-Me-6-Et | G1 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G1 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G1 |
| Me | 6-Me-3-F | G1 |
| Me | 6-Me-4-F | G1 |
| Me | 6-Me-5-F | G1 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G1 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G1 |
| Me | 6-Me-4-Br | G1 |
| Me | 6-Me-4-Et | G1 |
| Me | 4-OMe-3-F | G1 |
| Me | 4-OMe-5-F | G1 |
| Me | 4-OMe-6-F | G1 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G1 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G1 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G1 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G1 |
| Me | 4-F-5-Cl | G1 |
| Me | 4-F-6-Cl | G1 |
| Me | 4-F-6-Br | G1 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Me | 4-F-6-Et | G1 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G1 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G1 |
| Me | 4-Br-6-Et | G1 |
| Et | H | G1 |
| Et | 3-Me | G1 |
| Et | 4-Me | G1 |
| Et | 5-Me | G1 |
| Et | 6-Me | G1 |
| Et | 4-Et | G1 |
| Et | 4-t-Bu | G1 |
| Et | 4-i-Pr | G1 |
| Et | 4-OMe | G1 |
| Et | 6-OMe | G1 |
| Et | 3-F | G1 |
| Et | 4-F | G1 |
| Et | 5-F | G1 |
| Et | 6-F | G1 |
| Et | 4-Cl | G1 |
| Et | 6-Cl | G1 |
| Et | 4-Br | G1 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G1 |
| Pr | H | G1 |
| Pr | 4-Me | G1 |
| Pr | 6-Me | G1 |
| Pr | 4-Et | G1 |
| Pr | 4-OMe | G1 |
| Pr | 4-F | G1 |
| Pr | 4-Cl | G1 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G1 |
| i-Pr | H | G1 |
| F | H | G1 |
| F | 4-Me | G1 |
| F | 6-Me | G1 |
| F | 4-Et | G1 |
| F | 4-OMe | G1 |
| F | 4-F | G1 |
| F | 4-Cl | G1 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G1 |
| Cl | H | G1 |
| Cl | 3-Me | G1 |
| Cl | 4-Me | G1 |
| Cl | 5-Me | G1 |
| Cl | 6-Me | G1 |
| Cl | 4-Et | G1 |
| Cl | 4-t-Bu | G1 |
| Cl | 4-i-Pr | G1 |
| Cl | 4-OMe | G1 |
| Cl | 6-OMe | G1 |
| Cl | 3-F | G1 |
| Cl | 4-F | G1 |
| Cl | 5-F | G1 |
| Cl | 6-F | G1 |
| Cl | 4-Cl | G1 |
| Cl | 6-Cl | G1 |
| Cl | 4-Br | G1 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G1 |
| Br | H | G1 |

| | | |
|-----------------|------------------------|----|
| Br | 3-Me | G1 |
| Br | 4-Me | G1 |
| Br | 5-Me | G1 |
| Br | 6-Me | G1 |
| Br | 4-Et | G1 |
| Br | 4-t-Bu | G1 |
| Br | 4-i-Pr | G1 |
| Br | 4-OMe | G1 |
| Br | 6-OMe | G1 |
| Br | 3-F | G1 |
| Br | 4-F | G1 |
| Br | 5-F | G1 |
| Br | 6-F | G1 |
| Br | 4-Cl | G1 |
| Br | 6-Cl | G1 |
| Br | 4-Br | G1 |
| Br | 4,6-Me ₂ | G1 |
| OMe | H | G1 |
| SMe | H | G1 |
| SMe | 4-Me | G1 |
| SMe | 6-Me | G1 |
| SMe | 4-Et | G1 |
| SMe | 4-OMe | G1 |
| SMe | 4-F | G1 |
| SMe | 4-Cl | G1 |
| SMe | 4,6-Me ₂ | G1 |
| CF ₃ | H | G1 |
| CN | H | G1 |
| H | H | G2 |
| H | 3-Me | G2 |
| H | 4-Me | G2 |
| H | 5-Me | G2 |
| H | 6-Me | G2 |
| H | 4-Et | G2 |
| H | 4-t-Bu | G2 |
| H | 4-i-Pr | G2 |
| H | 4-CF ₃ | G2 |
| H | 4-OMe | G2 |
| H | 6-OMe | G2 |
| H | 4-OEt | G2 |
| H | 4-SMe | G2 |
| H | 4-NMe ₂ | G2 |
| H | 3-F | G2 |
| H | 4-F | G2 |
| H | 5-F | G2 |
| H | 6-F | G2 |
| H | 4-Cl | G2 |
| H | 6-Cl | G2 |
| H | 4-Br | G2 |
| H | 4-I | G2 |
| H | 4-CN | G2 |
| H | 4,5-Me ₂ | G2 |
| H | 4,6-Me ₂ | G2 |
| H | 4,5-(OMe) ₂ | G2 |
| Me | H | G2 |
| Me | 3-Me | G2 |
| Me | 4-Me | G2 |
| Me | 5-Me | G2 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| Me | 6-Me | G2 |
| Me | 3-Et | G2 |
| Me | 4-Et | G2 |
| Me | 5-Et | G2 |
| Me | 6-Et | G2 |
| Me | 4-t-Bu | G2 |
| Me | 4-i-Pr | G2 |
| Me | 3-CF ₃ | G2 |
| Me | 4-CF ₃ | G2 |
| Me | 5-CF ₃ | G2 |
| Me | 6-CF ₃ | G2 |
| Me | 3-OMe | G2 |
| Me | 4-OMe | G2 |
| Me | 5-OMe | G2 |
| Me | 6-OMe | G2 |
| Me | 3-OEt | G2 |
| Me | 4-OEt | G2 |
| Me | 5-OEt | G2 |
| Me | 6-OEt | G2 |
| Me | 3-SMe | G2 |
| Me | 4-SMe | G2 |
| Me | 5-SMe | G2 |
| Me | 6-SMe | G2 |
| Me | 3-NMe ₂ | G2 |
| Me | 4-NMe ₂ | G2 |
| Me | 5-NMe ₂ | G2 |
| Me | 6-NMe ₂ | G2 |
| Me | 3-F | G2 |
| Me | 4-F | G2 |
| Me | 5-F | G2 |
| Me | 6-F | G2 |
| Me | 3-Cl | G2 |
| Me | 4-Cl | G2 |
| Me | 5-Cl | G2 |
| Me | 6-Cl | G2 |
| Me | 3-Br | G2 |
| Me | 4-Br | G2 |
| Me | 5-Br | G2 |
| Me | 6-Br | G2 |
| Me | 3-I | G2 |
| Me | 4-I | G2 |
| Me | 5-I | G2 |
| Me | 6-I | G2 |
| Me | 3-CN | G2 |
| Me | 4-CN | G2 |
| Me | 5-CN | G2 |
| Me | 6-CN | G2 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G2 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G2 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G2 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G2 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G2 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G2 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G2 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G2 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G2 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G2 |

| | | |
|----|----------------------|----|
| Me | 3, 6-F ₂ | G2 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G2 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G2 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G2 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G2 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G2 |
| Me | 4-Me-3-F | G2 |
| Me | 4-Me-5-F | G2 |
| Me | 4-Me-6-F | G2 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G2 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G2 |
| Me | 4-Me-6-Br | G2 |
| Me | 4-Me-6-Et | G2 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G2 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G2 |
| Me | 6-Me-3-F | G2 |
| Me | 6-Me-4-F | G2 |
| Me | 6-Me-5-F | G2 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G2 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G2 |
| Me | 6-Me-4-Br | G2 |
| Me | 6-Me-4-Et | G2 |
| Me | 4-OMe-3-F | G2 |
| Me | 4-OMe-5-F | G2 |
| Me | 4-OMe-6-F | G2 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G2 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G2 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G2 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G2 |
| Me | 4-F-5-Cl | G2 |
| Me | 4-F-6-Cl | G2 |
| Me | 4-F-6-Br | G2 |
| Me | 4-F-6-Et | G2 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G2 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G2 |
| Me | 4-Br-6-Et | G2 |
| Et | H | G2 |
| Et | 3-Me | G2 |
| Et | 4-Me | G2 |
| Et | 5-Me | G2 |
| Et | 6-Me | G2 |
| Et | 4-Et | G2 |
| Et | 4-t-Bu | G2 |
| Et | 4-i-Pr | G2 |
| Et | 4-OMe | G2 |
| Et | 6-OMe | G2 |
| Et | 3-F | G2 |
| Et | 4-F | G2 |
| Et | 5-F | G2 |
| Et | 6-F | G2 |
| Et | 4-Cl | G2 |
| Et | 6-Cl | G2 |
| Et | 4-Br | G2 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| Pr | H | G2 |
| Pr | 4-Me | G2 |
| Pr | 6-Me | G2 |
| Pr | 4-Et | G2 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Pr | 4-OMe | G2 |
| Pr | 4-F | G2 |
| Pr | 4-Cl | G2 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| i-Pr | H | G2 |
| F | H | G2 |
| F | 4-Me | G2 |
| F | 6-Me | G2 |
| F | 4-Et | G2 |
| F | 4-OMe | G2 |
| F | 4-F | G2 |
| F | 4-Cl | G2 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| Cl | H | G2 |
| Cl | 3-Me | G2 |
| Cl | 4-Me | G2 |
| Cl | 5-Me | G2 |
| Cl | 6-Me | G2 |
| Cl | 4-Et | G2 |
| Cl | 4-t-Bu | G2 |
| Cl | 4-i-Pr | G2 |
| Cl | 4-OMe | G2 |
| Cl | 6-OMe | G2 |
| Cl | 3-F | G2 |
| Cl | 4-F | G2 |
| Cl | 5-F | G2 |
| Cl | 6-F | G2 |
| Cl | 4-Cl | G2 |
| Cl | 6-Cl | G2 |
| Cl | 4-Br | G2 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| Br | H | G2 |
| Br | 3-Me | G2 |
| Br | 4-Me | G2 |
| Br | 5-Me | G2 |
| Br | 6-Me | G2 |
| Br | 4-Et | G2 |
| Br | 4-t-Bu | G2 |
| Br | 4-i-Pr | G2 |
| Br | 4-OMe | G2 |
| Br | 6-OMe | G2 |
| Br | 3-F | G2 |
| Br | 4-F | G2 |
| Br | 5-F | G2 |
| Br | 6-F | G2 |
| Br | 4-Cl | G2 |
| Br | 6-Cl | G2 |
| Br | 4-Br | G2 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G2 |
| OMe | H | G2 |
| SMe | H | G2 |
| SMe | 4-Me | G2 |
| SMe | 6-Me | G2 |
| SMe | 4-Et | G2 |
| SMe | 4-OMe | G2 |
| SMe | 4-F | G2 |
| SMe | 4-Cl | G2 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G2 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|----|
| CF ₃ | H | G2 |
| CN | H | G2 |
| H | H | G3 |
| H | 3-Me | G3 |
| H | 4-Me | G3 |
| H | 5-Me | G3 |
| H | 6-Me | G3 |
| H | 4-Et | G3 |
| H | 4-t-Bu | G3 |
| H | 4-i-Pr | G3 |
| H | 4-CF ₃ | G3 |
| H | 4-OMe | G3 |
| H | 6-OMe | G3 |
| H | 4-OEt | G3 |
| H | 4-SMe | G3 |
| H | 4-NMe ₂ | G3 |
| H | 3-F | G3 |
| H | 4-F | G3 |
| H | 5-F | G3 |
| H | 6-F | G3 |
| H | 4-Cl | G3 |
| H | 6-Cl | G3 |
| H | 4-Br | G3 |
| H | 4-I | G3 |
| H | 4-CN | G3 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G3 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G3 |
| Me | H | G3 |
| Me | 3-Me | G3 |
| Me | 4-Me | G3 |
| Me | 5-Me | G3 |
| Me | 6-Me | G3 |
| Me | 3-Et | G3 |
| Me | 4-Et | G3 |
| Me | 5-Et | G3 |
| Me | 6-Et | G3 |
| Me | 4-t-Bu | G3 |
| Me | 4-i-Pr | G3 |
| Me | 3-CF ₃ | G3 |
| Me | 4-CF ₃ | G3 |
| Me | 5-CF ₃ | G3 |
| Me | 6-CF ₃ | G3 |
| Me | 3-OMe | G3 |
| Me | 4-OMe | G3 |
| Me | 5-OMe | G3 |
| Me | 6-OMe | G3 |
| Me | 3-OEt | G3 |
| Me | 4-OEt | G3 |
| Me | 5-OEt | G3 |
| Me | 6-OEt | G3 |
| Me | 3-SMe | G3 |
| Me | 4-SMe | G3 |
| Me | 5-SMe | G3 |
| Me | 6-SMe | G3 |
| Me | 3-NMe ₂ | G3 |
| Me | 4-NMe ₂ | G3 |
| Me | 5-NMe ₂ | G3 |

| | | |
|----|------------------------|----|
| Me | 6-NMe ₂ | G3 |
| Me | 3-F | G3 |
| Me | 4-F | G3 |
| Me | 5-F | G3 |
| Me | 6-F | G3 |
| Me | 3-Cl | G3 |
| Me | 4-Cl | G3 |
| Me | 5-Cl | G3 |
| Me | 6-Cl | G3 |
| Me | 3-Br | G3 |
| Me | 4-Br | G3 |
| Me | 5-Br | G3 |
| Me | 6-Br | G3 |
| Me | 3-I | G3 |
| Me | 4-I | G3 |
| Me | 5-I | G3 |
| Me | 6-I | G3 |
| Me | 3-CN | G3 |
| Me | 4-CN | G3 |
| Me | 5-CN | G3 |
| Me | 6-CN | G3 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G3 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G3 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G3 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G3 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G3 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G3 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G3 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G3 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G3 |
| Me | 3,4-F ₂ | G3 |
| Me | 3,5-F ₂ | G3 |
| Me | 3,6-F ₂ | G3 |
| Me | 4,5-F ₂ | G3 |
| Me | 4,6-F ₂ | G3 |
| Me | 5,6-F ₂ | G3 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G3 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G3 |
| Me | 4-Me-3-F | G3 |
| Me | 4-Me-5-F | G3 |
| Me | 4-Me-6-F | G3 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G3 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G3 |
| Me | 4-Me-6-Br | G3 |
| Me | 4-Me-6-Et | G3 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G3 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G3 |
| Me | 6-Me-3-F | G3 |
| Me | 6-Me-4-F | G3 |
| Me | 6-Me-5-F | G3 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G3 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G3 |
| Me | 6-Me-4-Br | G3 |
| Me | 6-Me-4-Et | G3 |
| Me | 4-OMe-3-F | G3 |
| Me | 4-OMe-5-F | G3 |
| Me | 4-OMe-6-F | G3 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G3 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Me | 4-OMe-6-Cl | G3 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G3 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G3 |
| Me | 4-F-5-Cl | G3 |
| Me | 4-F-6-Cl | G3 |
| Me | 4-F-6-Br | G3 |
| Me | 4-F-6-Et | G3 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G3 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G3 |
| Me | 4-Br-6-Et | G3 |
| Et | H | G3 |
| Et | 3-Me | G3 |
| Et | 4-Me | G3 |
| Et | 5-Me | G3 |
| Et | 6-Me | G3 |
| Et | 4-Et | G3 |
| Et | 4-t-Bu | G3 |
| Et | 4-i-Pr | G3 |
| Et | 4-OMe | G3 |
| Et | 6-OMe | G3 |
| Et | 3-F | G3 |
| Et | 4-F | G3 |
| Et | 5-F | G3 |
| Et | 6-F | G3 |
| Et | 4-Cl | G3 |
| Et | 6-Cl | G3 |
| Et | 4-Br | G3 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| Pr | H | G3 |
| Pr | 4-Me | G3 |
| Pr | 6-Me | G3 |
| Pr | 4-Et | G3 |
| Pr | 4-OMe | G3 |
| Pr | 4-F | G3 |
| Pr | 4-Cl | G3 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| i-Pr | H | G3 |
| F | H | G3 |
| F | 4-Me | G3 |
| F | 6-Me | G3 |
| F | 4-Et | G3 |
| F | 4-OMe | G3 |
| F | 4-F | G3 |
| F | 4-Cl | G3 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| Cl | H | G3 |
| Cl | 3-Me | G3 |
| Cl | 4-Me | G3 |
| Cl | 5-Me | G3 |
| Cl | 6-Me | G3 |
| Cl | 4-Et | G3 |
| Cl | 4-t-Bu | G3 |
| Cl | 4-i-Pr | G3 |
| Cl | 4-OMe | G3 |
| Cl | 6-OMe | G3 |
| Cl | 3-F | G3 |
| Cl | 4-F | G3 |
| Cl | 5-F | G3 |

| | | |
|-----------------|----------------------|----|
| Cl | 6-F | G3 |
| Cl | 4-Cl | G3 |
| Cl | 6-Cl | G3 |
| Cl | 4-Br | G3 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| Br | H | G3 |
| Br | 3-Me | G3 |
| Br | 4-Me | G3 |
| Br | 5-Me | G3 |
| Br | 6-Me | G3 |
| Br | 4-Et | G3 |
| Br | 4-t-Bu | G3 |
| Br | 4-i-Pr | G3 |
| Br | 4-OMe | G3 |
| Br | 6-OMe | G3 |
| Br | 3-F | G3 |
| Br | 4-F | G3 |
| Br | 5-F | G3 |
| Br | 6-F | G3 |
| Br | 4-Cl | G3 |
| Br | 6-Cl | G3 |
| Br | 4-Br | G3 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| OMe | H | G3 |
| SMe | H | G3 |
| SMe | 4-Me | G3 |
| SMe | 6-Me | G3 |
| SMe | 4-Et | G3 |
| SMe | 4-OMe | G3 |
| SMe | 4-F | G3 |
| SMe | 4-Cl | G3 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G3 |
| CF ₃ | H | G3 |
| CN | H | G3 |
| H | H | G4 |
| H | 3-Me | G4 |
| H | 4-Me | G4 |
| H | 5-Me | G4 |
| H | 6-Me | G4 |
| H | 4-Et | G4 |
| H | 4-t-Bu | G4 |
| H | 4-i-Pr | G4 |
| H | 4-CF ₃ | G4 |
| H | 4-OMe | G4 |
| H | 6-OMe | G4 |
| H | 4-OEt | G4 |
| H | 4-SMe | G4 |
| H | 4-NMe ₂ | G4 |
| H | 3-F | G4 |
| H | 4-F | G4 |
| H | 5-F | G4 |
| H | 6-F | G4 |
| H | 4-Cl | G4 |
| H | 6-Cl | G4 |
| H | 4-Br | G4 |
| H | 4-I | G4 |
| H | 4-CN | G4 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G4 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| H | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G4 |
| Me | H | G4 |
| Me | 3-Me | G4 |
| Me | 4-Me | G4 |
| Me | 5-Me | G4 |
| Me | 6-Me | G4 |
| Me | 3-Et | G4 |
| Me | 4-Et | G4 |
| Me | 5-Et | G4 |
| Me | 6-Et | G4 |
| Me | 4-t-Bu | G4 |
| Me | 4-i-Pr | G4 |
| Me | 3-CF ₃ | G4 |
| Me | 4-CF ₃ | G4 |
| Me | 5-CF ₃ | G4 |
| Me | 6-CF ₃ | G4 |
| Me | 3-OMe | G4 |
| Me | 4-OMe | G4 |
| Me | 5-OMe | G4 |
| Me | 6-OMe | G4 |
| Me | 3-OEt | G4 |
| Me | 4-OEt | G4 |
| Me | 5-OEt | G4 |
| Me | 6-OEt | G4 |
| Me | 3-SMe | G4 |
| Me | 4-SMe | G4 |
| Me | 5-SMe | G4 |
| Me | 6-SMe | G4 |
| Me | 3-NMe ₂ | G4 |
| Me | 4-NMe ₂ | G4 |
| Me | 5-NMe ₂ | G4 |
| Me | 6-NMe ₂ | G4 |
| Me | 3-F | G4 |
| Me | 4-F | G4 |
| Me | 5-F | G4 |
| Me | 6-F | G4 |
| Me | 3-Cl | G4 |
| Me | 4-Cl | G4 |
| Me | 5-Cl | G4 |
| Me | 6-Cl | G4 |
| Me | 3-Br | G4 |
| Me | 4-Br | G4 |
| Me | 5-Br | G4 |
| Me | 6-Br | G4 |
| Me | 3-I | G4 |
| Me | 4-I | G4 |
| Me | 5-I | G4 |
| Me | 6-I | G4 |
| Me | 3-CN | G4 |
| Me | 4-CN | G4 |
| Me | 5-CN | G4 |
| Me | 6-CN | G4 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G4 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G4 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G4 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G4 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G4 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G4 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G4 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G4 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G4 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G4 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G4 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G4 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G4 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G4 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G4 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G4 |
| Me | 4-Me-3-F | G4 |
| Me | 4-Me-5-F | G4 |
| Me | 4-Me-6-F | G4 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G4 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G4 |
| Me | 4-Me-6-Br | G4 |
| Me | 4-Me-6-Et | G4 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G4 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G4 |
| Me | 6-Me-3-F | G4 |
| Me | 6-Me-4-F | G4 |
| Me | 6-Me-5-F | G4 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G4 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G4 |
| Me | 6-Me-4-Br | G4 |
| Me | 6-Me-4-Et | G4 |
| Me | 4-OMe-3-F | G4 |
| Me | 4-OMe-5-F | G4 |
| Me | 4-OMe-6-F | G4 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G4 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G4 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G4 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G4 |
| Me | 4-F-5-Cl | G4 |
| Me | 4-F-6-Cl | G4 |
| Me | 4-F-6-Br | G4 |
| Me | 4-F-6-Et | G4 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G4 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G4 |
| Me | 4-Br-6-Et | G4 |
| Et | H | G4 |
| Et | 3-Me | G4 |
| Et | 4-Me | G4 |
| Et | 5-Me | G4 |
| Et | 6-Me | G4 |
| Et | 4-Et | G4 |
| Et | 4-t-Bu | G4 |
| Et | 4-i-Pr | G4 |
| Et | 4-OMe | G4 |
| Et | 6-OMe | G4 |
| Et | 3-F | G4 |
| Et | 4-F | G4 |
| Et | 5-F | G4 |
| Et | 6-F | G4 |
| Et | 4-Cl | G4 |
| Et | 6-Cl | G4 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Et | 4-Br | G4 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| Pr | H | G4 |
| Pr | 4-Me | G4 |
| Pr | 6-Me | G4 |
| Pr | 4-Et | G4 |
| Pr | 4-OMe | G4 |
| Pr | 4-F | G4 |
| Pr | 4-Cl | G4 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| i-Pr | H | G4 |
| F | H | G4 |
| F | 4-Me | G4 |
| F | 6-Me | G4 |
| F | 4-Et | G4 |
| F | 4-OMe | G4 |
| F | 4-F | G4 |
| F | 4-Cl | G4 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| Cl | H | G4 |
| Cl | 3-Me | G4 |
| Cl | 4-Me | G4 |
| Cl | 5-Me | G4 |
| Cl | 6-Me | G4 |
| Cl | 4-Et | G4 |
| Cl | 4-t-Bu | G4 |
| Cl | 4-i-Pr | G4 |
| Cl | 4-OMe | G4 |
| Cl | 6-OMe | G4 |
| Cl | 3-F | G4 |
| Cl | 4-F | G4 |
| Cl | 5-F | G4 |
| Cl | 6-F | G4 |
| Cl | 4-Cl | G4 |
| Cl | 6-Cl | G4 |
| Cl | 4-Br | G4 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| Br | H | G4 |
| Br | 3-Me | G4 |
| Br | 4-Me | G4 |
| Br | 5-Me | G4 |
| Br | 6-Me | G4 |
| Br | 4-Et | G4 |
| Br | 4-t-Bu | G4 |
| Br | 4-i-Pr | G4 |
| Br | 4-OMe | G4 |
| Br | 6-OMe | G4 |
| Br | 3-F | G4 |
| Br | 4-F | G4 |
| Br | 5-F | G4 |
| Br | 6-F | G4 |
| Br | 4-Cl | G4 |
| Br | 6-Cl | G4 |
| Br | 4-Br | G4 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| OMe | H | G4 |
| SMe | H | G4 |
| SMe | 4-Me | G4 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|----|
| SMe | 6-Me | G4 |
| SMe | 4-Et | G4 |
| SMe | 4-OMe | G4 |
| SMe | 4-F | G4 |
| SMe | 4-Cl | G4 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G4 |
| CF ₃ | H | G4 |
| CN | H | G4 |
| H | H | G5 |
| H | 3-Me | G5 |
| H | 4-Me | G5 |
| H | 5-Me | G5 |
| H | 6-Me | G5 |
| H | 4-Et | G5 |
| H | 4-t-Bu | G5 |
| H | 4-i-Pr | G5 |
| H | 4-CF ₃ | G5 |
| H | 4-OMe | G5 |
| H | 6-OMe | G5 |
| H | 4-OEt | G5 |
| H | 4-SMe | G5 |
| H | 4-NMe ₂ | G5 |
| H | 3-F | G5 |
| H | 4-F | G5 |
| H | 5-F | G5 |
| H | 6-F | G5 |
| H | 4-Cl | G5 |
| H | 6-Cl | G5 |
| H | 4-Br | G5 |
| H | 4-I | G5 |
| H | 4-CN | G5 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G5 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G5 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G5 |
| Me | H | G5 |
| Me | 3-Me | G5 |
| Me | 4-Me | G5 |
| Me | 5-Me | G5 |
| Me | 6-Me | G5 |
| Me | 3-Et | G5 |
| Me | 4-Et | G5 |
| Me | 5-Et | G5 |
| Me | 6-Et | G5 |
| Me | 4-t-Bu | G5 |
| Me | 4-i-Pr | G5 |
| Me | 3-CF ₃ | G5 |
| Me | 4-CF ₃ | G5 |
| Me | 5-CF ₃ | G5 |
| Me | 6-CF ₃ | G5 |
| Me | 3-OMe | G5 |
| Me | 4-OMe | G5 |
| Me | 5-OMe | G5 |
| Me | 6-OMe | G5 |
| Me | 3-OEt | G5 |
| Me | 4-OEt | G5 |
| Me | 5-OEt | G5 |
| Me | 6-OEt | G5 |
| Me | 3-SMe | G5 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| Me | 4-SMe | G5 |
| Me | 5-SMe | G5 |
| Me | 6-SMe | G5 |
| Me | 3-NMe ₂ | G5 |
| Me | 4-NMe ₂ | G5 |
| Me | 5-NMe ₂ | G5 |
| Me | 6-NMe ₂ | G5 |
| Me | 3-F | G5 |
| Me | 4-F | G5 |
| Me | 5-F | G5 |
| Me | 6-F | G5 |
| Me | 3-Cl | G5 |
| Me | 4-Cl | G5 |
| Me | 5-Cl | G5 |
| Me | 6-Cl | G5 |
| Me | 3-Br | G5 |
| Me | 4-Br | G5 |
| Me | 5-Br | G5 |
| Me | 6-Br | G5 |
| Me | 3-I | G5 |
| Me | 4-I | G5 |
| Me | 5-I | G5 |
| Me | 6-I | G5 |
| Me | 3-CN | G5 |
| Me | 4-CN | G5 |
| Me | 5-CN | G5 |
| Me | 6-CN | G5 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G5 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G5 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G5 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G5 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G5 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G5 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G5 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G5 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G5 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G5 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G5 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G5 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G5 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G5 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G5 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G5 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G5 |
| Me | 4-Me-3-F | G5 |
| Me | 4-Me-5-F | G5 |
| Me | 4-Me-6-F | G5 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G5 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G5 |
| Me | 4-Me-6-Br | G5 |
| Me | 4-Me-6-Et | G5 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G5 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G5 |
| Me | 6-Me-3-F | G5 |
| Me | 6-Me-4-F | G5 |
| Me | 6-Me-5-F | G5 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G5 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G5 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Me | 6-Me-4-Br | G5 |
| Me | 6-Me-4-Et | G5 |
| Me | 4-OMe-3-F | G5 |
| Me | 4-OMe-5-F | G5 |
| Me | 4-OMe-6-F | G5 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G5 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G5 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G5 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G5 |
| Me | 4-F-5-Cl | G5 |
| Me | 4-F-6-Cl | G5 |
| Me | 4-F-6-Br | G5 |
| Me | 4-F-6-Et | G5 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G5 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G5 |
| Me | 4-Br-6-Et | G5 |
| Et | H | G5 |
| Et | 3-Me | G5 |
| Et | 4-Me | G5 |
| Et | 5-Me | G5 |
| Et | 6-Me | G5 |
| Et | 4-Et | G5 |
| Et | 4-t-Bu | G5 |
| Et | 4-i-Pr | G5 |
| Et | 4-OMe | G5 |
| Et | 6-OMe | G5 |
| Et | 3-F | G5 |
| Et | 4-F | G5 |
| Et | 5-F | G5 |
| Et | 6-F | G5 |
| Et | 4-Cl | G5 |
| Et | 6-Cl | G5 |
| Et | 4-Br | G5 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G5 |
| Pr | H | G5 |
| Pr | 4-Me | G5 |
| Pr | 6-Me | G5 |
| Pr | 4-Et | G5 |
| Pr | 4-OMe | G5 |
| Pr | 4-F | G5 |
| Pr | 4-Cl | G5 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G5 |
| i-Pr | H | G5 |
| F | H | G5 |
| F | 4-Me | G5 |
| F | 6-Me | G5 |
| F | 4-Et | G5 |
| F | 4-OMe | G5 |
| F | 4-F | G5 |
| F | 4-Cl | G5 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G5 |
| Cl | H | G5 |
| Cl | 3-Me | G5 |
| Cl | 4-Me | G5 |
| Cl | 5-Me | G5 |
| Cl | 6-Me | G5 |
| Cl | 4-Et | G5 |
| Cl | 4-t-Bu | G5 |

| | | |
|-----------------|---------------------|----|
| Cl | 4-i-Pr | G5 |
| Cl | 4-OMe | G5 |
| Cl | 6-OMe | G5 |
| Cl | 3-F | G5 |
| Cl | 4-F | G5 |
| Cl | 5-F | G5 |
| Cl | 6-F | G5 |
| Cl | 4-Cl | G5 |
| Cl | 6-Cl | G5 |
| Cl | 4-Br | G5 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | G5 |
| Br | H | G5 |
| Br | 3-Me | G5 |
| Br | 4-Me | G5 |
| Br | 5-Me | G5 |
| Br | 6-Me | G5 |
| Br | 4-Et | G5 |
| Br | 4-t-Bu | G5 |
| Br | 4-i-Pr | G5 |
| Br | 4-OMe | G5 |
| Br | 6-OMe | G5 |
| Br | 3-F | G5 |
| Br | 4-F | G5 |
| Br | 5-F | G5 |
| Br | 6-F | G5 |
| Br | 4-Cl | G5 |
| Br | 6-Cl | G5 |
| Br | 4-Br | G5 |
| Br | 4,6-Me ₂ | G5 |
| OMe | H | G5 |
| SMe | H | G5 |
| SMe | 4-Me | G5 |
| SMe | 6-Me | G5 |
| SMe | 4-Et | G5 |
| SMe | 4-OMe | G5 |
| SMe | 4-F | G5 |
| SMe | 4-Cl | G5 |
| SMe | 4,6-Me ₂ | G5 |
| CF ₃ | H | G5 |
| CN | H | G5 |
| H | H | G6 |
| H | 3-Me | G6 |
| H | 4-Me | G6 |
| H | 5-Me | G6 |
| H | 6-Me | G6 |
| H | 4-Et | G6 |
| H | 4-t-Bu | G6 |
| H | 4-i-Pr | G6 |
| H | 4-CF ₃ | G6 |
| H | 4-OMe | G6 |
| H | 6-OMe | G6 |
| H | 4-OEt | G6 |
| H | 4-SMe | G6 |
| H | 4-NMe ₂ | G6 |
| H | 3-F | G6 |
| H | 4-F | G6 |
| H | 5-F | G6 |
| H | 6-F | G6 |

| | | |
|----|------------------------|----|
| H | 4-Cl | G6 |
| H | 6-Cl | G6 |
| H | 4-Br | G6 |
| H | 4-I | G6 |
| H | 4-CN | G6 |
| H | 4,5-Me ₂ | G6 |
| H | 4,6-Me ₂ | G6 |
| H | 4,5-(OMe) ₂ | G6 |
| Me | H | G6 |
| Me | 3-Me | G6 |
| Me | 4-Me | G6 |
| Me | 5-Me | G6 |
| Me | 6-Me | G6 |
| Me | 3-Et | G6 |
| Me | 4-Et | G6 |
| Me | 5-Et | G6 |
| Me | 6-Et | G6 |
| Me | 4-t-Bu | G6 |
| Me | 4-i-Pr | G6 |
| Me | 3-CF ₃ | G6 |
| Me | 4-CF ₃ | G6 |
| Me | 5-CF ₃ | G6 |
| Me | 6-CF ₃ | G6 |
| Me | 3-OMe | G6 |
| Me | 4-OMe | G6 |
| Me | 5-OMe | G6 |
| Me | 6-OMe | G6 |
| Me | 3-OEt | G6 |
| Me | 4-OEt | G6 |
| Me | 5-OEt | G6 |
| Me | 6-OEt | G6 |
| Me | 3-SMe | G6 |
| Me | 4-SMe | G6 |
| Me | 5-SMe | G6 |
| Me | 6-SMe | G6 |
| Me | 3-NMe ₂ | G6 |
| Me | 4-NMe ₂ | G6 |
| Me | 5-NMe ₂ | G6 |
| Me | 6-NMe ₂ | G6 |
| Me | 3-F | G6 |
| Me | 4-F | G6 |
| Me | 5-F | G6 |
| Me | 6-F | G6 |
| Me | 3-Cl | G6 |
| Me | 4-Cl | G6 |
| Me | 5-Cl | G6 |
| Me | 6-Cl | G6 |
| Me | 3-Br | G6 |
| Me | 4-Br | G6 |
| Me | 5-Br | G6 |
| Me | 6-Br | G6 |
| Me | 3-I | G6 |
| Me | 4-I | G6 |
| Me | 5-I | G6 |
| Me | 6-I | G6 |
| Me | 3-CN | G6 |
| Me | 4-CN | G6 |
| Me | 5-CN | G6 |

| | | |
|----|------------------------|----|
| Me | 6-CN | G6 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G6 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G6 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G6 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G6 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G6 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G6 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G6 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G6 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G6 |
| Me | 3,4-F ₂ | G6 |
| Me | 3,5-F ₂ | G6 |
| Me | 3,6-F ₂ | G6 |
| Me | 4,5-F ₂ | G6 |
| Me | 4,6-F ₂ | G6 |
| Me | 5,6-F ₂ | G6 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G6 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G6 |
| Me | 4-Me-3-F | G6 |
| Me | 4-Me-5-F | G6 |
| Me | 4-Me-6-F | G6 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G6 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G6 |
| Me | 4-Me-6-Br | G6 |
| Me | 4-Me-6-Et | G6 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G6 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G6 |
| Me | 6-Me-3-F | G6 |
| Me | 6-Me-4-F | G6 |
| Me | 6-Me-5-F | G6 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G6 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G6 |
| Me | 6-Me-4-Br | G6 |
| Me | 6-Me-4-Et | G6 |
| Me | 4-OMe-3-F | G6 |
| Me | 4-OMe-5-F | G6 |
| Me | 4-OMe-6-F | G6 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G6 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G6 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G6 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G6 |
| Me | 4-F-5-Cl | G6 |
| Me | 4-F-6-Cl | G6 |
| Me | 4-F-6-Br | G6 |
| Me | 4-F-6-Et | G6 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G6 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G6 |
| Me | 4-Br-6-Et | G6 |
| Et | H | G6 |
| Et | 3-Me | G6 |
| Et | 4-Me | G6 |
| Et | 5-Me | G6 |
| Et | 6-Me | G6 |
| Et | 4-Et | G6 |
| Et | 4-t-Bu | G6 |
| Et | 4-i-Pr | G6 |
| Et | 4-OMe | G6 |
| Et | 6-OMe | G6 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Et | 3-F | G6 |
| Et | 4-F | G6 |
| Et | 5-F | G6 |
| Et | 6-F | G6 |
| Et | 4-Cl | G6 |
| Et | 6-Cl | G6 |
| Et | 4-Br | G6 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| Pr | H | G6 |
| Pr | 4-Me | G6 |
| Pr | 6-Me | G6 |
| Pr | 4-Et | G6 |
| Pr | 4-OMe | G6 |
| Pr | 4-F | G6 |
| Pr | 4-Cl | G6 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| i-Pr | H | G6 |
| F | H | G6 |
| F | 4-Me | G6 |
| F | 6-Me | G6 |
| F | 4-Et | G6 |
| F | 4-OMe | G6 |
| F | 4-F | G6 |
| F | 4-Cl | G6 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| Cl | H | G6 |
| Cl | 3-Me | G6 |
| Cl | 4-Me | G6 |
| Cl | 5-Me | G6 |
| Cl | 6-Me | G6 |
| Cl | 4-Et | G6 |
| Cl | 4-t-Bu | G6 |
| Cl | 4-i-Pr | G6 |
| Cl | 4-OMe | G6 |
| Cl | 6-OMe | G6 |
| Cl | 3-F | G6 |
| Cl | 4-F | G6 |
| Cl | 5-F | G6 |
| Cl | 6-F | G6 |
| Cl | 4-Cl | G6 |
| Cl | 6-Cl | G6 |
| Cl | 4-Br | G6 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| Br | H | G6 |
| Br | 3-Me | G6 |
| Br | 4-Me | G6 |
| Br | 5-Me | G6 |
| Br | 6-Me | G6 |
| Br | 4-Et | G6 |
| Br | 4-t-Bu | G6 |
| Br | 4-i-Pr | G6 |
| Br | 4-OMe | G6 |
| Br | 6-OMe | G6 |
| Br | 3-F | G6 |
| Br | 4-F | G6 |
| Br | 5-F | G6 |
| Br | 6-F | G6 |
| Br | 4-Cl | G6 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|----|
| Br | 6-Cl | G6 |
| Br | 4-Br | G6 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| OMe | H | G6 |
| SMe | H | G6 |
| SMe | 4-Me | G6 |
| SMe | 6-Me | G6 |
| SMe | 4-Et | G6 |
| SMe | 4-OMe | G6 |
| SMe | 4-F | G6 |
| SMe | 4-Cl | G6 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G6 |
| CF ₃ | H | G6 |
| CN | H | G6 |
| H | H | G7 |
| H | 3-Me | G7 |
| H | 4-Me | G7 |
| H | 5-Me | G7 |
| H | 6-Me | G7 |
| H | 4-Et | G7 |
| H | 4-t-Bu | G7 |
| H | 4-i-Pr | G7 |
| H | 4-CF ₃ | G7 |
| H | 4-OMe | G7 |
| H | 6-OMe | G7 |
| H | 4-OEt | G7 |
| H | 4-SMe | G7 |
| H | 4-NMe ₂ | G7 |
| H | 3-F | G7 |
| H | 4-F | G7 |
| H | 5-F | G7 |
| H | 6-F | G7 |
| H | 4-Cl | G7 |
| H | 6-Cl | G7 |
| H | 4-Br | G7 |
| H | 4-I | G7 |
| H | 4-CN | G7 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G7 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G7 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G7 |
| Me | H | G7 |
| Me | 3-Me | G7 |
| Me | 4-Me | G7 |
| Me | 5-Me | G7 |
| Me | 6-Me | G7 |
| Me | 3-Et | G7 |
| Me | 4-Et | G7 |
| Me | 5-Et | G7 |
| Me | 6-Et | G7 |
| Me | 4-t-Bu | G7 |
| Me | 4-i-Pr | G7 |
| Me | 3-CF ₃ | G7 |
| Me | 4-CF ₃ | G7 |
| Me | 5-CF ₃ | G7 |
| Me | 6-CF ₃ | G7 |
| Me | 3-OMe | G7 |
| Me | 4-OMe | G7 |
| Me | 5-OMe | G7 |

| | | |
|----|------------------------|----|
| Me | 6-OMe | G7 |
| Me | 3-OEt | G7 |
| Me | 4-OEt | G7 |
| Me | 5-OEt | G7 |
| Me | 6-OEt | G7 |
| Me | 3-SMe | G7 |
| Me | 4-SMe | G7 |
| Me | 5-SMe | G7 |
| Me | 6-SMe | G7 |
| Me | 3-NMe ₂ | G7 |
| Me | 4-NMe ₂ | G7 |
| Me | 5-NMe ₂ | G7 |
| Me | 6-NMe ₂ | G7 |
| Me | 3-F | G7 |
| Me | 4-F | G7 |
| Me | 5-F | G7 |
| Me | 6-F | G7 |
| Me | 3-Cl | G7 |
| Me | 4-Cl | G7 |
| Me | 5-Cl | G7 |
| Me | 6-Cl | G7 |
| Me | 3-Br | G7 |
| Me | 4-Br | G7 |
| Me | 5-Br | G7 |
| Me | 6-Br | G7 |
| Me | 3-I | G7 |
| Me | 4-I | G7 |
| Me | 5-I | G7 |
| Me | 6-I | G7 |
| Me | 3-CN | G7 |
| Me | 4-CN | G7 |
| Me | 5-CN | G7 |
| Me | 6-CN | G7 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G7 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G7 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G7 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G7 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G7 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G7 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G7 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G7 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G7 |
| Me | 3,4-F ₂ | G7 |
| Me | 3,5-F ₂ | G7 |
| Me | 3,6-F ₂ | G7 |
| Me | 4,5-F ₂ | G7 |
| Me | 4,6-F ₂ | G7 |
| Me | 5,6-F ₂ | G7 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G7 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G7 |
| Me | 4-Me-3-F | G7 |
| Me | 4-Me-5-F | G7 |
| Me | 4-Me-6-F | G7 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G7 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G7 |
| Me | 4-Me-6-Br | G7 |
| Me | 4-Me-6-Et | G7 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G7 |

| | | |
|------|---------------------|----|
| Me | 6-Me-5-OMe | G7 |
| Me | 6-Me-3-F | G7 |
| Me | 6-Me-4-F | G7 |
| Me | 6-Me-5-F | G7 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G7 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G7 |
| Me | 6-Me-4-Br | G7 |
| Me | 6-Me-4-Et | G7 |
| Me | 4-OMe-3-F | G7 |
| Me | 4-OMe-5-F | G7 |
| Me | 4-OMe-6-F | G7 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G7 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G7 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G7 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G7 |
| Me | 4-F-5-Cl | G7 |
| Me | 4-F-6-Cl | G7 |
| Me | 4-F-6-Br | G7 |
| Me | 4-F-6-Et | G7 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G7 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G7 |
| Me | 4-Br-6-Et | G7 |
| Et | H | G7 |
| Et | 3-Me | G7 |
| Et | 4-Me | G7 |
| Et | 5-Me | G7 |
| Et | 6-Me | G7 |
| Et | 4-Et | G7 |
| Et | 4-t-Bu | G7 |
| Et | 4-i-Pr | G7 |
| Et | 4-OMe | G7 |
| Et | 6-OMe | G7 |
| Et | 3-F | G7 |
| Et | 4-F | G7 |
| Et | 5-F | G7 |
| Et | 6-F | G7 |
| Et | 4-Cl | G7 |
| Et | 6-Cl | G7 |
| Et | 4-Br | G7 |
| Et | 4,6-Me ₂ | G7 |
| Pr | H | G7 |
| Pr | 4-Me | G7 |
| Pr | 6-Me | G7 |
| Pr | 4-Et | G7 |
| Pr | 4-OMe | G7 |
| Pr | 4-F | G7 |
| Pr | 4-Cl | G7 |
| Pr | 4,6-Me ₂ | G7 |
| i-Pr | H | G7 |
| F | H | G7 |
| F | 4-Me | G7 |
| F | 6-Me | G7 |
| F | 4-Et | G7 |
| F | 4-OMe | G7 |
| F | 4-F | G7 |
| F | 4-Cl | G7 |
| F | 4,6-Me ₂ | G7 |
| Cl | H | G7 |

| | | |
|-----------------|----------------------|----|
| Cl | 3-Me | G7 |
| Cl | 4-Me | G7 |
| Cl | 5-Me | G7 |
| Cl | 6-Me | G7 |
| Cl | 4-Et | G7 |
| Cl | 4-t-Bu | G7 |
| Cl | 4-i-Pr | G7 |
| Cl | 4-OMe | G7 |
| Cl | 6-OMe | G7 |
| Cl | 3-F | G7 |
| Cl | 4-F | G7 |
| Cl | 5-F | G7 |
| Cl | 6-F | G7 |
| Cl | 4-Cl | G7 |
| Cl | 6-Cl | G7 |
| Cl | 4-Br | G7 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G7 |
| Br | H | G7 |
| Br | 3-Me | G7 |
| Br | 4-Me | G7 |
| Br | 5-Me | G7 |
| Br | 6-Me | G7 |
| Br | 4-Et | G7 |
| Br | 4-t-Bu | G7 |
| Br | 4-i-Pr | G7 |
| Br | 4-OMe | G7 |
| Br | 6-OMe | G7 |
| Br | 3-F | G7 |
| Br | 4-F | G7 |
| Br | 5-F | G7 |
| Br | 6-F | G7 |
| Br | 4-Cl | G7 |
| Br | 6-Cl | G7 |
| Br | 4-Br | G7 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G7 |
| OMe | H | G7 |
| SMe | H | G7 |
| SMe | 4-Me | G7 |
| SMe | 6-Me | G7 |
| SMe | 4-Et | G7 |
| SMe | 4-OMe | G7 |
| SMe | 4-F | G7 |
| SMe | 4-Cl | G7 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G7 |
| CF ₃ | H | G7 |
| CN | H | G7 |
| H | H | G8 |
| H | 3-Me | G8 |
| H | 4-Me | G8 |
| H | 5-Me | G8 |
| H | 6-Me | G8 |
| H | 4-Et | G8 |
| H | 4-t-Bu | G8 |
| H | 4-i-Pr | G8 |
| H | 4-CF ₃ | G8 |
| H | 4-OMe | G8 |
| H | 6-OMe | G8 |
| H | 4-OEt | G8 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| H | 4-SMe | G8 |
| H | 4-NMe ₂ | G8 |
| H | 3-F | G8 |
| H | 4-F | G8 |
| H | 5-F | G8 |
| H | 6-F | G8 |
| H | 4-Cl | G8 |
| H | 6-Cl | G8 |
| H | 4-Br | G8 |
| H | 4-I | G8 |
| H | 4-CN | G8 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G8 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G8 |
| Me | H | G8 |
| Me | 3-Me | G8 |
| Me | 4-Me | G8 |
| Me | 5-Me | G8 |
| Me | 6-Me | G8 |
| Me | 3-Et | G8 |
| Me | 4-Et | G8 |
| Me | 5-Et | G8 |
| Me | 6-Et | G8 |
| Me | 4-t-Bu | G8 |
| Me | 4-i-Pr | G8 |
| Me | 3-CF ₃ | G8 |
| Me | 4-CF ₃ | G8 |
| Me | 5-CF ₃ | G8 |
| Me | 6-CF ₃ | G8 |
| Me | 3-OMe | G8 |
| Me | 4-OMe | G8 |
| Me | 5-OMe | G8 |
| Me | 6-OMe | G8 |
| Me | 3-OEt | G8 |
| Me | 4-OEt | G8 |
| Me | 5-OEt | G8 |
| Me | 6-OEt | G8 |
| Me | 3-SMe | G8 |
| Me | 4-SMe | G8 |
| Me | 5-SMe | G8 |
| Me | 6-SMe | G8 |
| Me | 3-NMe ₂ | G8 |
| Me | 4-NMe ₂ | G8 |
| Me | 5-NMe ₂ | G8 |
| Me | 6-NMe ₂ | G8 |
| Me | 3-F | G8 |
| Me | 4-F | G8 |
| Me | 5-F | G8 |
| Me | 6-F | G8 |
| Me | 3-Cl | G8 |
| Me | 4-Cl | G8 |
| Me | 5-Cl | G8 |
| Me | 6-Cl | G8 |
| Me | 3-Br | G8 |
| Me | 4-Br | G8 |
| Me | 5-Br | G8 |
| Me | 6-Br | G8 |
| Me | 3-I | G8 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| Me | 4-I | G8 |
| Me | 5-I | G8 |
| Me | 6-I | G8 |
| Me | 3-CN | G8 |
| Me | 4-CN | G8 |
| Me | 5-CN | G8 |
| Me | 6-CN | G8 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G8 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G8 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G8 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G8 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G8 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G8 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G8 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G8 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G8 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G8 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G8 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G8 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G8 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G8 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G8 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G8 |
| Me | 4-Me-3-F | G8 |
| Me | 4-Me-5-F | G8 |
| Me | 4-Me-6-F | G8 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G8 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G8 |
| Me | 4-Me-6-Br | G8 |
| Me | 4-Me-6-Et | G8 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G8 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G8 |
| Me | 6-Me-3-F | G8 |
| Me | 6-Me-4-F | G8 |
| Me | 6-Me-5-F | G8 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G8 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G8 |
| Me | 6-Me-4-Br | G8 |
| Me | 6-Me-4-Et | G8 |
| Me | 4-OMe-3-F | G8 |
| Me | 4-OMe-5-F | G8 |
| Me | 4-OMe-6-F | G8 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G8 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G8 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G8 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G8 |
| Me | 4-F-5-Cl | G8 |
| Me | 4-F-6-Cl | G8 |
| Me | 4-F-6-Br | G8 |
| Me | 4-F-6-Et | G8 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G8 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G8 |
| Me | 4-Br-6-Et | G8 |
| Et | H | G8 |
| Et | 3-Me | G8 |
| Et | 4-Me | G8 |
| Et | 5-Me | G8 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Et | 6-Me | G8 |
| Et | 4-Et | G8 |
| Et | 4-t-Bu | G8 |
| Et | 4-i-Pr | G8 |
| Et | 4-OMe | G8 |
| Et | 6-OMe | G8 |
| Et | 3-F | G8 |
| Et | 4-F | G8 |
| Et | 5-F | G8 |
| Et | 6-F | G8 |
| Et | 4-Cl | G8 |
| Et | 6-Cl | G8 |
| Et | 4-Br | G8 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| Pr | H | G8 |
| Pr | 4-Me | G8 |
| Pr | 6-Me | G8 |
| Pr | 4-Et | G8 |
| Pr | 4-OMe | G8 |
| Pr | 4-F | G8 |
| Pr | 4-Cl | G8 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| i-Pr | H | G8 |
| F | H | G8 |
| F | 4-Me | G8 |
| F | 6-Me | G8 |
| F | 4-Et | G8 |
| F | 4-OMe | G8 |
| F | 4-F | G8 |
| F | 4-Cl | G8 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| Cl | H | G8 |
| Cl | 3-Me | G8 |
| Cl | 4-Me | G8 |
| Cl | 5-Me | G8 |
| Cl | 6-Me | G8 |
| Cl | 4-Et | G8 |
| Cl | 4-t-Bu | G8 |
| Cl | 4-i-Pr | G8 |
| Cl | 4-OMe | G8 |
| Cl | 6-OMe | G8 |
| Cl | 3-F | G8 |
| Cl | 4-F | G8 |
| Cl | 5-F | G8 |
| Cl | 6-F | G8 |
| Cl | 4-Cl | G8 |
| Cl | 6-Cl | G8 |
| Cl | 4-Br | G8 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| Br | H | G8 |
| Br | 3-Me | G8 |
| Br | 4-Me | G8 |
| Br | 5-Me | G8 |
| Br | 6-Me | G8 |
| Br | 4-Et | G8 |
| Br | 4-t-Bu | G8 |
| Br | 4-i-Pr | G8 |
| Br | 4-OMe | G8 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|----|
| Br | 6-OMe | G8 |
| Br | 3-F | G8 |
| Br | 4-F | G8 |
| Br | 5-F | G8 |
| Br | 6-F | G8 |
| Br | 4-Cl | G8 |
| Br | 6-Cl | G8 |
| Br | 4-Br | G8 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| OMe | H | G8 |
| SMe | H | G8 |
| SMe | 4-Me | G8 |
| SMe | 6-Me | G8 |
| SMe | 4-Et | G8 |
| SMe | 4-OMe | G8 |
| SMe | 4-F | G8 |
| SMe | 4-Cl | G8 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G8 |
| CF ₃ | H | G8 |
| CN | H | G8 |
| H | H | G9 |
| H | 3-Me | G9 |
| H | 4-Me | G9 |
| H | 5-Me | G9 |
| H | 6-Me | G9 |
| H | 4-Et | G9 |
| H | 4-t-Bu | G9 |
| H | 4-i-Pr | G9 |
| H | 4-CF ₃ | G9 |
| H | 4-OMe | G9 |
| H | 6-OMe | G9 |
| H | 4-OEt | G9 |
| H | 4-SMe | G9 |
| H | 4-NMe ₂ | G9 |
| H | 3-F | G9 |
| H | 4-F | G9 |
| H | 5-F | G9 |
| H | 6-F | G9 |
| H | 4-Cl | G9 |
| H | 6-Cl | G9 |
| H | 4-Br | G9 |
| H | 4-I | G9 |
| H | 4-CN | G9 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G9 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G9 |
| Me | H | G9 |
| Me | 3-Me | G9 |
| Me | 4-Me | G9 |
| Me | 5-Me | G9 |
| Me | 6-Me | G9 |
| Me | 3-Et | G9 |
| Me | 4-Et | G9 |
| Me | 5-Et | G9 |
| Me | 6-Et | G9 |
| Me | 4-t-Bu | G9 |
| Me | 4-i-Pr | G9 |
| Me | 3-CF ₃ | G9 |

| | | |
|----|-------------------------|----|
| Me | 4-CF ₃ | G9 |
| Me | 5-CF ₃ | G9 |
| Me | 6-CF ₃ | G9 |
| Me | 3-OMe | G9 |
| Me | 4-OMe | G9 |
| Me | 5-OMe | G9 |
| Me | 6-OMe | G9 |
| Me | 3-OEt | G9 |
| Me | 4-OEt | G9 |
| Me | 5-OEt | G9 |
| Me | 6-OEt | G9 |
| Me | 3-SMe | G9 |
| Me | 4-SMe | G9 |
| Me | 5-SMe | G9 |
| Me | 6-SMe | G9 |
| Me | 3-NMe ₂ | G9 |
| Me | 4-NMe ₂ | G9 |
| Me | 5-NMe ₂ | G9 |
| Me | 6-NMe ₂ | G9 |
| Me | 3-F | G9 |
| Me | 4-F | G9 |
| Me | 5-F | G9 |
| Me | 6-F | G9 |
| Me | 3-Cl | G9 |
| Me | 4-Cl | G9 |
| Me | 5-Cl | G9 |
| Me | 6-Cl | G9 |
| Me | 3-Br | G9 |
| Me | 4-Br | G9 |
| Me | 5-Br | G9 |
| Me | 6-Br | G9 |
| Me | 3-I | G9 |
| Me | 4-I | G9 |
| Me | 5-I | G9 |
| Me | 6-I | G9 |
| Me | 3-CN | G9 |
| Me | 4-CN | G9 |
| Me | 5-CN | G9 |
| Me | 6-CN | G9 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G9 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G9 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G9 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G9 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G9 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G9 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G9 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G9 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G9 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G9 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G9 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G9 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G9 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G9 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G9 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G9 |
| Me | 4-Me-3-F | G9 |
| Me | 4-Me-5-F | G9 |

| | | |
|------|----------------------|----|
| Me | 4-Me-6-F | G9 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G9 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G9 |
| Me | 4-Me-6-Br | G9 |
| Me | 4-Me-6-Et | G9 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G9 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G9 |
| Me | 6-Me-3-F | G9 |
| Me | 6-Me-4-F | G9 |
| Me | 6-Me-5-F | G9 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G9 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G9 |
| Me | 6-Me-4-Br | G9 |
| Me | 6-Me-4-Et | G9 |
| Me | 4-OMe-3-F | G9 |
| Me | 4-OMe-5-F | G9 |
| Me | 4-OMe-6-F | G9 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G9 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G9 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G9 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G9 |
| Me | 4-F-5-Cl | G9 |
| Me | 4-F-6-Cl | G9 |
| Me | 4-F-6-Br | G9 |
| Me | 4-F-6-Et | G9 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G9 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G9 |
| Me | 4-Br-6-Et | G9 |
| Et | H | G9 |
| Et | 3-Me | G9 |
| Et | 4-Me | G9 |
| Et | 5-Me | G9 |
| Et | 6-Me | G9 |
| Et | 4-Et | G9 |
| Et | 4-t-Bu | G9 |
| Et | 4-i-Pr | G9 |
| Et | 4-OMe | G9 |
| Et | 6-OMe | G9 |
| Et | 3-F | G9 |
| Et | 4-F | G9 |
| Et | 5-F | G9 |
| Et | 6-F | G9 |
| Et | 4-Cl | G9 |
| Et | 6-Cl | G9 |
| Et | 4-Br | G9 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| Pr | H | G9 |
| Pr | 4-Me | G9 |
| Pr | 6-Me | G9 |
| Pr | 4-Et | G9 |
| Pr | 4-OMe | G9 |
| Pr | 4-F | G9 |
| Pr | 4-Cl | G9 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| i-Pr | H | G9 |
| F | H | G9 |
| F | 4-Me | G9 |
| F | 6-Me | G9 |

| | | |
|-----------------|----------------------|-----|
| F | 4-Et | G9 |
| F | 4-OMe | G9 |
| F | 4-F | G9 |
| F | 4-Cl | G9 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| Cl | H | G9 |
| Cl | 3-Me | G9 |
| Cl | 4-Me | G9 |
| Cl | 5-Me | G9 |
| Cl | 6-Me | G9 |
| Cl | 4-Et | G9 |
| Cl | 4-t-Bu | G9 |
| Cl | 4-i-Pr | G9 |
| Cl | 4-OMe | G9 |
| Cl | 6-OMe | G9 |
| Cl | 3-F | G9 |
| Cl | 4-F | G9 |
| Cl | 5-F | G9 |
| Cl | 6-F | G9 |
| Cl | 4-Cl | G9 |
| Cl | 6-Cl | G9 |
| Cl | 4-Br | G9 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| Br | H | G9 |
| Br | 3-Me | G9 |
| Br | 4-Me | G9 |
| Br | 5-Me | G9 |
| Br | 6-Me | G9 |
| Br | 4-Et | G9 |
| Br | 4-t-Bu | G9 |
| Br | 4-i-Pr | G9 |
| Br | 4-OMe | G9 |
| Br | 6-OMe | G9 |
| Br | 3-F | G9 |
| Br | 4-F | G9 |
| Br | 5-F | G9 |
| Br | 6-F | G9 |
| Br | 4-Cl | G9 |
| Br | 6-Cl | G9 |
| Br | 4-Br | G9 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| OMe | H | G9 |
| SMe | H | G9 |
| SMe | 4-Me | G9 |
| SMe | 6-Me | G9 |
| SMe | 4-Et | G9 |
| SMe | 4-OMe | G9 |
| SMe | 4-F | G9 |
| SMe | 4-Cl | G9 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G9 |
| CF ₃ | H | G9 |
| CN | H | G9 |
| H | H | G10 |
| H | 3-Me | G10 |
| H | 4-Me | G10 |
| H | 5-Me | G10 |
| H | 6-Me | G10 |
| H | 4-Et | G10 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| H | 4-t-Bu | G10 |
| H | 4-i-Pr | G10 |
| H | 4-CF ₃ | G10 |
| H | 4-OMe | G10 |
| H | 6-OMe | G10 |
| H | 4-OEt | G10 |
| H | 4-SMe | G10 |
| H | 4-NMe ₂ | G10 |
| H | 3-F | G10 |
| H | 4-F | G10 |
| H | 5-F | G10 |
| H | 6-F | G10 |
| H | 4-Cl | G10 |
| H | 6-Cl | G10 |
| H | 4-Br | G10 |
| H | 4-I | G10 |
| H | 4-CN | G10 |
| H | 4,5-Me ₂ | G10 |
| H | 4,6-Me ₂ | G10 |
| H | 4,5-(OMe) ₂ | G10 |
| Me | H | G10 |
| Me | 3-Me | G10 |
| Me | 4-Me | G10 |
| Me | 5-Me | G10 |
| Me | 6-Me | G10 |
| Me | 3-Et | G10 |
| Me | 4-Et | G10 |
| Me | 5-Et | G10 |
| Me | 6-Et | G10 |
| Me | 4-t-Bu | G10 |
| Me | 4-i-Pr | G10 |
| Me | 3-CF ₃ | G10 |
| Me | 4-CF ₃ | G10 |
| Me | 5-CF ₃ | G10 |
| Me | 6-CF ₃ | G10 |
| Me | 3-OMe | G10 |
| Me | 4-OMe | G10 |
| Me | 5-OMe | G10 |
| Me | 6-OMe | G10 |
| Me | 3-OEt | G10 |
| Me | 4-OEt | G10 |
| Me | 5-OEt | G10 |
| Me | 6-OEt | G10 |
| Me | 3-SMe | G10 |
| Me | 4-SMe | G10 |
| Me | 5-SMe | G10 |
| Me | 6-SMe | G10 |
| Me | 3-NMe ₂ | G10 |
| Me | 4-NMe ₂ | G10 |
| Me | 5-NMe ₂ | G10 |
| Me | 6-NMe ₂ | G10 |
| Me | 3-F | G10 |
| Me | 4-F | G10 |
| Me | 5-F | G10 |
| Me | 6-F | G10 |
| Me | 3-Cl | G10 |
| Me | 4-Cl | G10 |
| Me | 5-Cl | G10 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| Me | 6-Cl | G10 |
| Me | 3-Br | G10 |
| Me | 4-Br | G10 |
| Me | 5-Br | G10 |
| Me | 6-Br | G10 |
| Me | 3-I | G10 |
| Me | 4-I | G10 |
| Me | 5-I | G10 |
| Me | 6-I | G10 |
| Me | 3-CN | G10 |
| Me | 4-CN | G10 |
| Me | 5-CN | G10 |
| Me | 6-CN | G10 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G10 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G10 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G10 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G10 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G10 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G10 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G10 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G10 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G10 |
| Me | 3,4-F ₂ | G10 |
| Me | 3,5-F ₂ | G10 |
| Me | 3,6-F ₂ | G10 |
| Me | 4,5-F ₂ | G10 |
| Me | 4,6-F ₂ | G10 |
| Me | 5,6-F ₂ | G10 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G10 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G10 |
| Me | 4-Me-3-F | G10 |
| Me | 4-Me-5-F | G10 |
| Me | 4-Me-6-F | G10 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G10 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G10 |
| Me | 4-Me-6-Br | G10 |
| Me | 4-Me-6-Et | G10 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G10 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G10 |
| Me | 6-Me-3-F | G10 |
| Me | 6-Me-4-F | G10 |
| Me | 6-Me-5-F | G10 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G10 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G10 |
| Me | 6-Me-4-Br | G10 |
| Me | 6-Me-4-Et | G10 |
| Me | 4-OMe-3-F | G10 |
| Me | 4-OMe-5-F | G10 |
| Me | 4-OMe-6-F | G10 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G10 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G10 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G10 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G10 |
| Me | 4-F-5-Cl | G10 |
| Me | 4-F-6-Cl | G10 |
| Me | 4-F-6-Br | G10 |
| Me | 4-F-6-Et | G10 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G10 |

| | | |
|------|----------------------|-----|
| Me | 4-Cl-6-Et | G10 |
| Me | 4-Br-6-Et | G10 |
| Et | H | G10 |
| Et | 3-Me | G10 |
| Et | 4-Me | G10 |
| Et | 5-Me | G10 |
| Et | 6-Me | G10 |
| Et | 4-Et | G10 |
| Et | 4-t-Bu | G10 |
| Et | 4-i-Pr | G10 |
| Et | 4-OMe | G10 |
| Et | 6-OMe | G10 |
| Et | 3-F | G10 |
| Et | 4-F | G10 |
| Et | 5-F | G10 |
| Et | 6-F | G10 |
| Et | 4-Cl | G10 |
| Et | 6-Cl | G10 |
| Et | 4-Br | G10 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| Pr | H | G10 |
| Pr | 4-Me | G10 |
| Pr | 6-Me | G10 |
| Pr | 4-Et | G10 |
| Pr | 4-OMe | G10 |
| Pr | 4-F | G10 |
| Pr | 4-Cl | G10 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| i-Pr | H | G10 |
| F | H | G10 |
| F | 4-Me | G10 |
| F | 6-Me | G10 |
| F | 4-Et | G10 |
| F | 4-OMe | G10 |
| F | 4-F | G10 |
| F | 4-Cl | G10 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| Cl | H | G10 |
| Cl | 3-Me | G10 |
| Cl | 4-Me | G10 |
| Cl | 5-Me | G10 |
| Cl | 6-Me | G10 |
| Cl | 4-Et | G10 |
| Cl | 4-t-Bu | G10 |
| Cl | 4-i-Pr | G10 |
| Cl | 4-OMe | G10 |
| Cl | 6-OMe | G10 |
| Cl | 3-F | G10 |
| Cl | 4-F | G10 |
| Cl | 5-F | G10 |
| Cl | 6-F | G10 |
| Cl | 4-Cl | G10 |
| Cl | 6-Cl | G10 |
| Cl | 4-Br | G10 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| Br | H | G10 |
| Br | 3-Me | G10 |
| Br | 4-Me | G10 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|-----|
| Br | 5-Me | G10 |
| Br | 6-Me | G10 |
| Br | 4-Et | G10 |
| Br | 4-t-Bu | G10 |
| Br | 4-i-Pr | G10 |
| Br | 4-OMe | G10 |
| Br | 6-OMe | G10 |
| Br | 3-F | G10 |
| Br | 4-F | G10 |
| Br | 5-F | G10 |
| Br | 6-F | G10 |
| Br | 4-Cl | G10 |
| Br | 6-Cl | G10 |
| Br | 4-Br | G10 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| OMe | H | G10 |
| SMe | H | G10 |
| SMe | 4-Me | G10 |
| SMe | 6-Me | G10 |
| SMe | 4-Et | G10 |
| SMe | 4-OMe | G10 |
| SMe | 4-F | G10 |
| SMe | 4-Cl | G10 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G10 |
| CF ₃ | H | G10 |
| CN | H | G11 |
| H | H | G11 |
| H | 3-Me | G11 |
| H | 4-Me | G11 |
| H | 5-Me | G11 |
| H | 6-Me | G11 |
| H | 4-Et | G11 |
| H | 4-t-Bu | G11 |
| H | 4-i-Pr | G11 |
| H | 4-CF ₃ | G11 |
| H | 4-OMe | G11 |
| H | 6-OMe | G11 |
| H | 4-OEt | G11 |
| H | 4-SMe | G11 |
| H | 4-NMe ₂ | G11 |
| H | 3-F | G11 |
| H | 4-F | G11 |
| H | 5-F | G11 |
| H | 6-F | G11 |
| H | 4-Cl | G11 |
| H | 6-Cl | G11 |
| H | 4-Br | G11 |
| H | 4-I | G11 |
| H | 4-CN | G11 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G11 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G11 |
| Me | H | G11 |
| Me | 3-Me | G11 |
| Me | 4-Me | G11 |
| Me | 5-Me | G11 |
| Me | 6-Me | G11 |
| Me | 3-Et | G11 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| Me | 4-Et | G11 |
| Me | 5-Et | G11 |
| Me | 6-Et | G11 |
| Me | 4-t-Bu | G11 |
| Me | 4-i-Pr | G11 |
| Me | 3-CF ₃ | G11 |
| Me | 4-CF ₃ | G11 |
| Me | 5-CF ₃ | G11 |
| Me | 6-CF ₃ | G11 |
| Me | 3-OMe | G11 |
| Me | 4-OMe | G11 |
| Me | 5-OMe | G11 |
| Me | 6-OMe | G11 |
| Me | 3-OEt | G11 |
| Me | 4-OEt | G11 |
| Me | 5-OEt | G11 |
| Me | 6-OEt | G11 |
| Me | 3-SMe | G11 |
| Me | 4-SMe | G11 |
| Me | 5-SMe | G11 |
| Me | 6-SMe | G11 |
| Me | 3-NMe ₂ | G11 |
| Me | 4-NMe ₂ | G11 |
| Me | 5-NMe ₂ | G11 |
| Me | 6-NMe ₂ | G11 |
| Me | 3-F | G11 |
| Me | 4-F | G11 |
| Me | 5-F | G11 |
| Me | 6-F | G11 |
| Me | 3-Cl | G11 |
| Me | 4-Cl | G11 |
| Me | 5-Cl | G11 |
| Me | 6-Cl | G11 |
| Me | 3-Br | G11 |
| Me | 4-Br | G11 |
| Me | 5-Br | G11 |
| Me | 6-Br | G11 |
| Me | 3-I | G11 |
| Me | 4-I | G11 |
| Me | 5-I | G11 |
| Me | 6-I | G11 |
| Me | 3-CN | G11 |
| Me | 4-CN | G11 |
| Me | 5-CN | G11 |
| Me | 6-CN | G11 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G11 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G11 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G11 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G11 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G11 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G11 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G11 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G11 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G11 |
| Me | 3,4-F ₂ | G11 |
| Me | 3,5-F ₂ | G11 |
| Me | 3,6-F ₂ | G11 |
| Me | 4,5-F ₂ | G11 |

| | | |
|----|----------------------|-----|
| Me | 4, 6-F ₂ | G11 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G11 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G11 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G11 |
| Me | 4-Me-3-F | G11 |
| Me | 4-Me-5-F | G11 |
| Me | 4-Me-6-F | G11 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G11 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G11 |
| Me | 4-Me-6-Br | G11 |
| Me | 4-Me-6-Et | G11 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G11 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G11 |
| Me | 6-Me-3-F | G11 |
| Me | 6-Me-4-F | G11 |
| Me | 6-Me-5-F | G11 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G11 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G11 |
| Me | 6-Me-4-Br | G11 |
| Me | 6-Me-4-Et | G11 |
| Me | 4-OMe-3-F | G11 |
| Me | 4-OMe-5-F | G11 |
| Me | 4-OMe-6-F | G11 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G11 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G11 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G11 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G11 |
| Me | 4-F-5-Cl | G11 |
| Me | 4-F-6-Cl | G11 |
| Me | 4-F-6-Br | G11 |
| Me | 4-F-6-Et | G11 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G11 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G11 |
| Me | 4-Br-6-Et | G11 |
| Et | H | G11 |
| Et | 3-Me | G11 |
| Et | 4-Me | G11 |
| Et | 5-Me | G11 |
| Et | 6-Me | G11 |
| Et | 4-Et | G11 |
| Et | 4-t-Bu | G11 |
| Et | 4-i-Pr | G11 |
| Et | 4-OMe | G11 |
| Et | 6-OMe | G11 |
| Et | 3-F | G11 |
| Et | 4-F | G11 |
| Et | 5-F | G11 |
| Et | 6-F | G11 |
| Et | 4-Cl | G11 |
| Et | 6-Cl | G11 |
| Et | 4-Br | G11 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| Pr | H | G11 |
| Pr | 4-Me | G11 |
| Pr | 6-Me | G11 |
| Pr | 4-Et | G11 |
| Pr | 4-OMe | G11 |
| Pr | 4-F | G11 |

| | | |
|-----------------|----------------------|-----|
| Pr | 4-Cl | G11 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| i-Pr | H | G11 |
| F | H | G11 |
| F | 4-Me | G11 |
| F | 6-Me | G11 |
| F | 4-Et | G11 |
| F | 4-OMe | G11 |
| F | 4-F | G11 |
| F | 4-Cl | G11 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| Cl | H | G11 |
| Cl | 3-Me | G11 |
| Cl | 4-Me | G11 |
| Cl | 5-Me | G11 |
| Cl | 6-Me | G11 |
| Cl | 4-Et | G11 |
| Cl | 4-t-Bu | G11 |
| Cl | 4-i-Pr | G11 |
| Cl | 4-OMe | G11 |
| Cl | 6-OMe | G11 |
| Cl | 3-F | G11 |
| Cl | 4-F | G11 |
| Cl | 5-F | G11 |
| Cl | 6-F | G11 |
| Cl | 4-Cl | G11 |
| Cl | 6-Cl | G11 |
| Cl | 4-Br | G11 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| Br | H | G11 |
| Br | 3-Me | G11 |
| Br | 4-Me | G11 |
| Br | 5-Me | G11 |
| Br | 6-Me | G11 |
| Br | 4-Et | G11 |
| Br | 4-t-Bu | G11 |
| Br | 4-i-Pr | G11 |
| Br | 4-OMe | G11 |
| Br | 6-OMe | G11 |
| Br | 3-F | G11 |
| Br | 4-F | G11 |
| Br | 5-F | G11 |
| Br | 6-F | G11 |
| Br | 4-Cl | G11 |
| Br | 6-Cl | G11 |
| Br | 4-Br | G11 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| OMe | H | G11 |
| SMe | H | G11 |
| SMe | 4-Me | G11 |
| SMe | 6-Me | G11 |
| SMe | 4-Et | G11 |
| SMe | 4-OMe | G11 |
| SMe | 4-F | G11 |
| SMe | 4-Cl | G11 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G11 |
| CF ₃ | H | G11 |
| CN | H | G11 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| H | H | G12 |
| H | 3-Me | G12 |
| H | 4-Me | G12 |
| H | 5-Me | G12 |
| H | 6-Me | G12 |
| H | 4-Et | G12 |
| H | 4-t-Bu | G12 |
| H | 4-i-Pr | G12 |
| H | 4-CF ₃ | G12 |
| H | 4-OMe | G12 |
| H | 6-OMe | G12 |
| H | 4-OEt | G12 |
| H | 4-SMe | G12 |
| H | 4-NMe ₂ | G12 |
| H | 3-F | G12 |
| H | 4-F | G12 |
| H | 5-F | G12 |
| H | 6-F | G12 |
| H | 4-Cl | G12 |
| H | 6-Cl | G12 |
| H | 4-Br | G12 |
| H | 4-I | G12 |
| H | 4-CN | G12 |
| H | 4,5-Me ₂ | G12 |
| H | 4,6-Me ₂ | G12 |
| H | 4,5-(OMe) ₂ | G12 |
| Me | H | G12 |
| Me | 3-Me | G12 |
| Me | 4-Me | G12 |
| Me | 5-Me | G12 |
| Me | 6-Me | G12 |
| Me | 3-Et | G12 |
| Me | 4-Et | G12 |
| Me | 5-Et | G12 |
| Me | 6-Et | G12 |
| Me | 4-t-Bu | G12 |
| Me | 4-i-Pr | G12 |
| Me | 3-CF ₃ | G12 |
| Me | 4-CF ₃ | G12 |
| Me | 5-CF ₃ | G12 |
| Me | 6-CF ₃ | G12 |
| Me | 3-OMe | G12 |
| Me | 4-OMe | G12 |
| Me | 5-OMe | G12 |
| Me | 6-OMe | G12 |
| Me | 3-OEt | G12 |
| Me | 4-OEt | G12 |
| Me | 5-OEt | G12 |
| Me | 6-OEt | G12 |
| Me | 3-SMe | G12 |
| Me | 4-SMe | G12 |
| Me | 5-SMe | G12 |
| Me | 6-SMe | G12 |
| Me | 3-NMe ₂ | G12 |
| Me | 4-NMe ₂ | G12 |
| Me | 5-NMe ₂ | G12 |
| Me | 6-NMe ₂ | G12 |
| Me | 3-F | G12 |

| | | |
|----|-------------------------|-----|
| Me | 4-F | G12 |
| Me | 5-F | G12 |
| Me | 6-F | G12 |
| Me | 3-Cl | G12 |
| Me | 4-Cl | G12 |
| Me | 5-Cl | G12 |
| Me | 6-Cl | G12 |
| Me | 3-Br | G12 |
| Me | 4-Br | G12 |
| Me | 5-Br | G12 |
| Me | 6-Br | G12 |
| Me | 3-I | G12 |
| Me | 4-I | G12 |
| Me | 5-I | G12 |
| Me | 6-I | G12 |
| Me | 3-CN | G12 |
| Me | 4-CN | G12 |
| Me | 5-CN | G12 |
| Me | 6-CN | G12 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G12 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G12 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G12 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G12 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G12 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G12 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G12 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G12 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G12 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G12 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G12 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G12 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G12 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G12 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G12 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G12 |
| Me | 4-Me-3-F | G12 |
| Me | 4-Me-5-F | G12 |
| Me | 4-Me-6-F | G12 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G12 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G12 |
| Me | 4-Me-6-Br | G12 |
| Me | 4-Me-6-Et | G12 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G12 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G12 |
| Me | 6-Me-3-F | G12 |
| Me | 6-Me-4-F | G12 |
| Me | 6-Me-5-F | G12 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G12 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G12 |
| Me | 6-Me-4-Br | G12 |
| Me | 6-Me-4-Et | G12 |
| Me | 4-OMe-3-F | G12 |
| Me | 4-OMe-5-F | G12 |
| Me | 4-OMe-6-F | G12 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G12 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G12 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G12 |

| | | |
|------|----------------------|-----|
| Me | 4-OMe-6-Et | G12 |
| Me | 4-F-5-Cl | G12 |
| Me | 4-F-6-Cl | G12 |
| Me | 4-F-6-Br | G12 |
| Me | 4-F-6-Et | G12 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G12 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G12 |
| Me | 4-Br-6-Et | G12 |
| Et | H | G12 |
| Et | 3-Me | G12 |
| Et | 4-Me | G12 |
| Et | 5-Me | G12 |
| Et | 6-Me | G12 |
| Et | 4-Et | G12 |
| Et | 4-t-Bu | G12 |
| Et | 4-i-Pr | G12 |
| Et | 4-OMe | G12 |
| Et | 6-OMe | G12 |
| Et | 3-F | G12 |
| Et | 4-F | G12 |
| Et | 5-F | G12 |
| Et | 6-F | G12 |
| Et | 4-Cl | G12 |
| Et | 6-Cl | G12 |
| Et | 4-Br | G12 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| Pr | H | G12 |
| Pr | 4-Me | G12 |
| Pr | 6-Me | G12 |
| Pr | 4-Et | G12 |
| Pr | 4-OMe | G12 |
| Pr | 4-F | G12 |
| Pr | 4-Cl | G12 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| i-Pr | H | G12 |
| F | H | G12 |
| F | 4-Me | G12 |
| F | 6-Me | G12 |
| F | 4-Et | G12 |
| F | 4-OMe | G12 |
| F | 4-F | G12 |
| F | 4-Cl | G12 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| Cl | H | G12 |
| Cl | 3-Me | G12 |
| Cl | 4-Me | G12 |
| Cl | 5-Me | G12 |
| Cl | 6-Me | G12 |
| Cl | 4-Et | G12 |
| Cl | 4-t-Bu | G12 |
| Cl | 4-i-Pr | G12 |
| Cl | 4-OMe | G12 |
| Cl | 6-OMe | G12 |
| Cl | 3-F | G12 |
| Cl | 4-F | G12 |
| Cl | 5-F | G12 |
| Cl | 6-F | G12 |
| Cl | 4-Cl | G12 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|-----|
| Cl | 6-Cl | G12 |
| Cl | 4-Br | G12 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| Br | H | G12 |
| Br | 3-Me | G12 |
| Br | 4-Me | G12 |
| Br | 5-Me | G12 |
| Br | 6-Me | G12 |
| Br | 4-Et | G12 |
| Br | 4-t-Bu | G12 |
| Br | 4-i-Pr | G12 |
| Br | 4-OMe | G12 |
| Br | 6-OMe | G12 |
| Br | 3-F | G12 |
| Br | 4-F | G12 |
| Br | 5-F | G12 |
| Br | 6-F | G12 |
| Br | 4-Cl | G12 |
| Br | 6-Cl | G12 |
| Br | 4-Br | G12 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| OMe | H | G12 |
| SMe | H | G12 |
| SMe | 4-Me | G12 |
| SMe | 6-Me | G12 |
| SMe | 4-Et | G12 |
| SMe | 4-OMe | G12 |
| SMe | 4-F | G12 |
| SMe | 4-Cl | G12 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G12 |
| CF ₃ | H | G12 |
| CN | H | G12 |
| H | H | G13 |
| H | 3-Me | G13 |
| H | 4-Me | G13 |
| H | 5-Me | G13 |
| H | 6-Me | G13 |
| H | 4-Et | G13 |
| H | 4-t-Bu | G13 |
| H | 4-i-Pr | G13 |
| H | 4-CF ₃ | G13 |
| H | 4-OMe | G13 |
| H | 6-OMe | G13 |
| H | 4-OEt | G13 |
| H | 4-SMe | G13 |
| H | 4-NMe ₂ | G13 |
| H | 3-F | G13 |
| H | 4-F | G13 |
| H | 5-F | G13 |
| H | 6-F | G13 |
| H | 4-Cl | G13 |
| H | 6-Cl | G13 |
| H | 4-Br | G13 |
| H | 4-I | G13 |
| H | 4-CN | G13 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G13 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G13 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| Me | H | G13 |
| Me | 3-Me | G13 |
| Me | 4-Me | G13 |
| Me | 5-Me | G13 |
| Me | 6-Me | G13 |
| Me | 3-Et | G13 |
| Me | 4-Et | G13 |
| Me | 5-Et | G13 |
| Me | 6-Et | G13 |
| Me | 4-t-Bu | G13 |
| Me | 4-i-Pr | G13 |
| Me | 3-CF ₃ | G13 |
| Me | 4-CF ₃ | G13 |
| Me | 5-CF ₃ | G13 |
| Me | 6-CF ₃ | G13 |
| Me | 3-OMe | G13 |
| Me | 4-OMe | G13 |
| Me | 5-OMe | G13 |
| Me | 6-OMe | G13 |
| Me | 3-OEt | G13 |
| Me | 4-OEt | G13 |
| Me | 5-OEt | G13 |
| Me | 6-OEt | G13 |
| Me | 3-SMe | G13 |
| Me | 4-SMe | G13 |
| Me | 5-SMe | G13 |
| Me | 6-SMe | G13 |
| Me | 3-NMe ₂ | G13 |
| Me | 4-NMe ₂ | G13 |
| Me | 5-NMe ₂ | G13 |
| Me | 6-NMe ₂ | G13 |
| Me | 3-F | G13 |
| Me | 4-F | G13 |
| Me | 5-F | G13 |
| Me | 6-F | G13 |
| Me | 3-Cl | G13 |
| Me | 4-Cl | G13 |
| Me | 5-Cl | G13 |
| Me | 6-Cl | G13 |
| Me | 3-Br | G13 |
| Me | 4-Br | G13 |
| Me | 5-Br | G13 |
| Me | 6-Br | G13 |
| Me | 3-I | G13 |
| Me | 4-I | G13 |
| Me | 5-I | G13 |
| Me | 6-I | G13 |
| Me | 3-CN | G13 |
| Me | 4-CN | G13 |
| Me | 5-CN | G13 |
| Me | 6-CN | G13 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G13 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G13 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G13 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G13 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G13 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G13 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G13 |

| | | |
|----|--------------------------|-----|
| Me | 4, 6- (OMe) ₂ | G13 |
| Me | 5, 6- (OMe) ₂ | G13 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G13 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G13 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G13 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G13 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G13 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G13 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G13 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G13 |
| Me | 4-Me-3-F | G13 |
| Me | 4-Me-5-F | G13 |
| Me | 4-Me-6-F | G13 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G13 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G13 |
| Me | 4-Me-6-Br | G13 |
| Me | 4-Me-6-Et | G13 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G13 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G13 |
| Me | 6-Me-3-F | G13 |
| Me | 6-Me-4-F | G13 |
| Me | 6-Me-5-F | G13 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G13 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G13 |
| Me | 6-Me-4-Br | G13 |
| Me | 6-Me-4-Et | G13 |
| Me | 4-OMe-3-F | G13 |
| Me | 4-OMe-5-F | G13 |
| Me | 4-OMe-6-F | G13 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G13 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G13 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G13 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G13 |
| Me | 4-F-5-Cl | G13 |
| Me | 4-F-6-Cl | G13 |
| Me | 4-F-6-Br | G13 |
| Me | 4-F-6-Et | G13 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G13 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G13 |
| Me | 4-Br-6-Et | G13 |
| Et | H | G13 |
| Et | 3-Me | G13 |
| Et | 4-Me | G13 |
| Et | 5-Me | G13 |
| Et | 6-Me | G13 |
| Et | 4-Et | G13 |
| Et | 4-t-Bu | G13 |
| Et | 4-i-Pr | G13 |
| Et | 4-OMe | G13 |
| Et | 6-OMe | G13 |
| Et | 3-F | G13 |
| Et | 4-F | G13 |
| Et | 5-F | G13 |
| Et | 6-F | G13 |
| Et | 4-Cl | G13 |
| Et | 6-Cl | G13 |
| Et | 4-Br | G13 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G13 |

| | | |
|------|----------------------|-----|
| Pr | H | G13 |
| Pr | 4-Me | G13 |
| Pr | 6-Me | G13 |
| Pr | 4-Et | G13 |
| Pr | 4-OMe | G13 |
| Pr | 4-F | G13 |
| Pr | 4-Cl | G13 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| i-Pr | H | G13 |
| F | H | G13 |
| F | 4-Me | G13 |
| F | 6-Me | G13 |
| F | 4-Et | G13 |
| F | 4-OMe | G13 |
| F | 4-F | G13 |
| F | 4-Cl | G13 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| Cl | H | G13 |
| Cl | 3-Me | G13 |
| Cl | 4-Me | G13 |
| Cl | 5-Me | G13 |
| Cl | 6-Me | G13 |
| Cl | 4-Et | G13 |
| Cl | 4-t-Bu | G13 |
| Cl | 4-i-Pr | G13 |
| Cl | 4-OMe | G13 |
| Cl | 6-OMe | G13 |
| Cl | 3-F | G13 |
| Cl | 4-F | G13 |
| Cl | 5-F | G13 |
| Cl | 6-F | G13 |
| Cl | 4-Cl | G13 |
| Cl | 6-Cl | G13 |
| Cl | 4-Br | G13 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| Br | H | G13 |
| Br | 3-Me | G13 |
| Br | 4-Me | G13 |
| Br | 5-Me | G13 |
| Br | 6-Me | G13 |
| Br | 4-Et | G13 |
| Br | 4-t-Bu | G13 |
| Br | 4-i-Pr | G13 |
| Br | 4-OMe | G13 |
| Br | 6-OMe | G13 |
| Br | 3-F | G13 |
| Br | 4-F | G13 |
| Br | 5-F | G13 |
| Br | 6-F | G13 |
| Br | 4-Cl | G13 |
| Br | 6-Cl | G13 |
| Br | 4-Br | G13 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| OMe | H | G13 |
| SMe | H | G13 |
| SMe | 4-Me | G13 |
| SMe | 6-Me | G13 |
| SMe | 4-Et | G13 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|-----|
| SMe | 4-OMe | G13 |
| SMe | 4-F | G13 |
| SMe | 4-Cl | G13 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G13 |
| CF ₃ | H | G13 |
| CN | H | G13 |
| H | H | G14 |
| H | 3-Me | G14 |
| H | 4-Me | G14 |
| H | 5-Me | G14 |
| H | 6-Me | G14 |
| H | 4-Et | G14 |
| H | 4-t-Bu | G14 |
| H | 4-i-Pr | G14 |
| H | 4-CF ₃ | G14 |
| H | 4-OMe | G14 |
| H | 6-OMe | G14 |
| H | 4-OEt | G14 |
| H | 4-SMe | G14 |
| H | 4-NMe ₂ | G14 |
| H | 3-F | G14 |
| H | 4-F | G14 |
| H | 5-F | G14 |
| H | 6-F | G14 |
| H | 4-Cl | G14 |
| H | 6-Cl | G14 |
| H | 4-Br | G14 |
| H | 4-I | G14 |
| H | 4-CN | G14 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G14 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G14 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G14 |
| Me | H | G14 |
| Me | 3-Me | G14 |
| Me | 4-Me | G14 |
| Me | 5-Me | G14 |
| Me | 6-Me | G14 |
| Me | 3-Et | G14 |
| Me | 4-Et | G14 |
| Me | 5-Et | G14 |
| Me | 6-Et | G14 |
| Me | 4-t-Bu | G14 |
| Me | 4-i-Pr | G14 |
| Me | 3-CF ₃ | G14 |
| Me | 4-CF ₃ | G14 |
| Me | 5-CF ₃ | G14 |
| Me | 6-CF ₃ | G14 |
| Me | 3-OMe | G14 |
| Me | 4-OMe | G14 |
| Me | 5-OMe | G14 |
| Me | 6-OMe | G14 |
| Me | 3-OEt | G14 |
| Me | 4-OEt | G14 |
| Me | 5-OEt | G14 |
| Me | 6-OEt | G14 |
| Me | 3-SMe | G14 |
| Me | 4-SMe | G14 |
| Me | 5-SMe | G14 |

| | | |
|----|-------------------------|-----|
| Me | 6-SMe | G14 |
| Me | 3-NMe ₂ | G14 |
| Me | 4-NMe ₂ | G14 |
| Me | 5-NMe ₂ | G14 |
| Me | 6-NMe ₂ | G14 |
| Me | 3-F | G14 |
| Me | 4-F | G14 |
| Me | 5-F | G14 |
| Me | 6-F | G14 |
| Me | 3-Cl | G14 |
| Me | 4-Cl | G14 |
| Me | 5-Cl | G14 |
| Me | 6-Cl | G14 |
| Me | 3-Br | G14 |
| Me | 4-Br | G14 |
| Me | 5-Br | G14 |
| Me | 6-Br | G14 |
| Me | 3-I | G14 |
| Me | 4-I | G14 |
| Me | 5-I | G14 |
| Me | 6-I | G14 |
| Me | 3-CN | G14 |
| Me | 4-CN | G14 |
| Me | 5-CN | G14 |
| Me | 6-CN | G14 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G14 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G14 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G14 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G14 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G14 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G14 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G14 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G14 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G14 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G14 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G14 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G14 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G14 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G14 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G14 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G14 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G14 |
| Me | 4-Me-3-F | G14 |
| Me | 4-Me-5-F | G14 |
| Me | 4-Me-6-F | G14 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G14 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G14 |
| Me | 4-Me-6-Br | G14 |
| Me | 4-Me-6-Et | G14 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G14 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G14 |
| Me | 6-Me-3-F | G14 |
| Me | 6-Me-4-F | G14 |
| Me | 6-Me-5-F | G14 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G14 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G14 |
| Me | 6-Me-4-Br | G14 |
| Me | 6-Me-4-Et | G14 |

| | | |
|------|---------------------|-----|
| Me | 4-OMe-3-F | G14 |
| Me | 4-OMe-5-F | G14 |
| Me | 4-OMe-6-F | G14 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G14 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G14 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G14 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G14 |
| Me | 4-F-5-Cl | G14 |
| Me | 4-F-6-Cl | G14 |
| Me | 4-F-6-Br | G14 |
| Me | 4-F-6-Et | G14 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G14 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G14 |
| Me | 4-Br-6-Et | G14 |
| Et | H | G14 |
| Et | 3-Me | G14 |
| Et | 4-Me | G14 |
| Et | 5-Me | G14 |
| Et | 6-Me | G14 |
| Et | 4-Et | G14 |
| Et | 4-t-Bu | G14 |
| Et | 4-i-Pr | G14 |
| Et | 4-OMe | G14 |
| Et | 6-OMe | G14 |
| Et | 3-F | G14 |
| Et | 4-F | G14 |
| Et | 5-F | G14 |
| Et | 6-F | G14 |
| Et | 4-Cl | G14 |
| Et | 6-Cl | G14 |
| Et | 4-Br | G14 |
| Et | 4,6-Me ₂ | G14 |
| Pr | H | G14 |
| Pr | 4-Me | G14 |
| Pr | 6-Me | G14 |
| Pr | 4-Et | G14 |
| Pr | 4-OMe | G14 |
| Pr | 4-F | G14 |
| Pr | 4-Cl | G14 |
| Pr | 4,6-Me ₂ | G14 |
| i-Pr | H | G14 |
| F | H | G14 |
| F | 4-Me | G14 |
| F | 6-Me | G14 |
| F | 4-Et | G14 |
| F | 4-OMe | G14 |
| F | 4-F | G14 |
| F | 4-Cl | G14 |
| F | 4,6-Me ₂ | G14 |
| Cl | H | G14 |
| Cl | 3-Me | G14 |
| Cl | 4-Me | G14 |
| Cl | 5-Me | G14 |
| Cl | 6-Me | G14 |
| Cl | 4-Et | G14 |
| Cl | 4-t-Bu | G14 |
| Cl | 4-i-Pr | G14 |
| Cl | 4-OMe | G14 |

| | | |
|-----------------|----------------------|-----|
| Cl | 6-OMe | G14 |
| Cl | 3-F | G14 |
| Cl | 4-F | G14 |
| Cl | 5-F | G14 |
| Cl | 6-F | G14 |
| Cl | 4-Cl | G14 |
| Cl | 6-Cl | G14 |
| Cl | 4-Br | G14 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G14 |
| Br | H | G14 |
| Br | 3-Me | G14 |
| Br | 4-Me | G14 |
| Br | 5-Me | G14 |
| Br | 6-Me | G14 |
| Br | 4-Et | G14 |
| Br | 4-t-Bu | G14 |
| Br | 4-i-Pr | G14 |
| Br | 4-OMe | G14 |
| Br | 6-OMe | G14 |
| Br | 3-F | G14 |
| Br | 4-F | G14 |
| Br | 5-F | G14 |
| Br | 6-F | G14 |
| Br | 4-Cl | G14 |
| Br | 6-Cl | G14 |
| Br | 4-Br | G14 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G14 |
| OMe | H | G14 |
| SMe | H | G14 |
| SMe | 4-Me | G14 |
| SMe | 6-Me | G14 |
| SMe | 4-Et | G14 |
| SMe | 4-OMe | G14 |
| SMe | 4-F | G14 |
| SMe | 4-Cl | G14 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G14 |
| CF ₃ | H | G14 |
| CN | H | G14 |
| H | H | G15 |
| H | 3-Me | G15 |
| H | 4-Me | G15 |
| H | 5-Me | G15 |
| H | 6-Me | G15 |
| H | 4-Et | G15 |
| H | 4-t-Bu | G15 |
| H | 4-i-Pr | G15 |
| H | 4-CF ₃ | G15 |
| H | 4-OMe | G15 |
| H | 6-OMe | G15 |
| H | 4-OEt | G15 |
| H | 4-SMe | G15 |
| H | 4-NMe ₂ | G15 |
| H | 3-F | G15 |
| H | 4-F | G15 |
| H | 5-F | G15 |
| H | 6-F | G15 |
| H | 4-Cl | G15 |
| H | 6-Cl | G15 |

| | | |
|----|-------------------------|-----|
| H | 4-Br | G15 |
| H | 4-I | G15 |
| H | 4-CN | G15 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G15 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G15 |
| Me | H | G15 |
| Me | 3-Me | G15 |
| Me | 4-Me | G15 |
| Me | 5-Me | G15 |
| Me | 6-Me | G15 |
| Me | 3-Et | G15 |
| Me | 4-Et | G15 |
| Me | 5-Et | G15 |
| Me | 6-Et | G15 |
| Me | 4-t-Bu | G15 |
| Me | 4-i-Pr | G15 |
| Me | 3-CF ₃ | G15 |
| Me | 4-CF ₃ | G15 |
| Me | 5-CF ₃ | G15 |
| Me | 6-CF ₃ | G15 |
| Me | 3-OMe | G15 |
| Me | 4-OMe | G15 |
| Me | 5-OMe | G15 |
| Me | 6-OMe | G15 |
| Me | 3-OEt | G15 |
| Me | 4-OEt | G15 |
| Me | 5-OEt | G15 |
| Me | 6-OEt | G15 |
| Me | 3-SMe | G15 |
| Me | 4-SMe | G15 |
| Me | 5-SMe | G15 |
| Me | 6-SMe | G15 |
| Me | 3-NMe ₂ | G15 |
| Me | 4-NMe ₂ | G15 |
| Me | 5-NMe ₂ | G15 |
| Me | 6-NMe ₂ | G15 |
| Me | 3-F | G15 |
| Me | 4-F | G15 |
| Me | 5-F | G15 |
| Me | 6-F | G15 |
| Me | 3-Cl | G15 |
| Me | 4-Cl | G15 |
| Me | 5-Cl | G15 |
| Me | 6-Cl | G15 |
| Me | 3-Br | G15 |
| Me | 4-Br | G15 |
| Me | 5-Br | G15 |
| Me | 6-Br | G15 |
| Me | 3-I | G15 |
| Me | 4-I | G15 |
| Me | 5-I | G15 |
| Me | 6-I | G15 |
| Me | 3-CN | G15 |
| Me | 4-CN | G15 |
| Me | 5-CN | G15 |
| Me | 6-CN | G15 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G15 |

| | | |
|----|-------------------------|-----|
| Me | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G15 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G15 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G15 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G15 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G15 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G15 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G15 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G15 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G15 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G15 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G15 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G15 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G15 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G15 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G15 |
| Me | 4-Me-3-F | G15 |
| Me | 4-Me-5-F | G15 |
| Me | 4-Me-6-F | G15 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G15 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G15 |
| Me | 4-Me-6-Br | G15 |
| Me | 4-Me-6-Et | G15 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G15 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G15 |
| Me | 6-Me-3-F | G15 |
| Me | 6-Me-4-F | G15 |
| Me | 6-Me-5-F | G15 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G15 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G15 |
| Me | 6-Me-4-Br | G15 |
| Me | 6-Me-4-Et | G15 |
| Me | 4-OMe-3-F | G15 |
| Me | 4-OMe-5-F | G15 |
| Me | 4-OMe-6-F | G15 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G15 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G15 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G15 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G15 |
| Me | 4-F-5-Cl | G15 |
| Me | 4-F-6-Cl | G15 |
| Me | 4-F-6-Br | G15 |
| Me | 4-F-6-Et | G15 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G15 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G15 |
| Me | 4-Br-6-Et | G15 |
| Et | H | G15 |
| Et | 3-Me | G15 |
| Et | 4-Me | G15 |
| Et | 5-Me | G15 |
| Et | 6-Me | G15 |
| Et | 4-Et | G15 |
| Et | 4-t-Bu | G15 |
| Et | 4-i-Pr | G15 |
| Et | 4-OMe | G15 |
| Et | 6-OMe | G15 |
| Et | 3-F | G15 |
| Et | 4-F | G15 |

| | | |
|------|----------------------|-----|
| Et | 5-F | G15 |
| Et | 6-F | G15 |
| Et | 4-Cl | G15 |
| Et | 6-Cl | G15 |
| Et | 4-Br | G15 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| Pr | H | G15 |
| Pr | 4-Me | G15 |
| Pr | 6-Me | G15 |
| Pr | 4-Et | G15 |
| Pr | 4-OMe | G15 |
| Pr | 4-F | G15 |
| Pr | 4-Cl | G15 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| i-Pr | H | G15 |
| F | H | G15 |
| F | 4-Me | G15 |
| F | 6-Me | G15 |
| F | 4-Et | G15 |
| F | 4-OMe | G15 |
| F | 4-F | G15 |
| F | 4-Cl | G15 |
| F | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| Cl | H | G15 |
| Cl | 3-Me | G15 |
| Cl | 4-Me | G15 |
| Cl | 5-Me | G15 |
| Cl | 6-Me | G15 |
| Cl | 4-Et | G15 |
| Cl | 4-t-Bu | G15 |
| Cl | 4-i-Pr | G15 |
| Cl | 4-OMe | G15 |
| Cl | 6-OMe | G15 |
| Cl | 3-F | G15 |
| Cl | 4-F | G15 |
| Cl | 5-F | G15 |
| Cl | 6-F | G15 |
| Cl | 4-Cl | G15 |
| Cl | 6-Cl | G15 |
| Cl | 4-Br | G15 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| Br | H | G15 |
| Br | 3-Me | G15 |
| Br | 4-Me | G15 |
| Br | 5-Me | G15 |
| Br | 6-Me | G15 |
| Br | 4-Et | G15 |
| Br | 4-t-Bu | G15 |
| Br | 4-i-Pr | G15 |
| Br | 4-OMe | G15 |
| Br | 6-OMe | G15 |
| Br | 3-F | G15 |
| Br | 4-F | G15 |
| Br | 5-F | G15 |
| Br | 6-F | G15 |
| Br | 4-Cl | G15 |
| Br | 6-Cl | G15 |
| Br | 4-Br | G15 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|-----|
| Br | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| OMe | H | G15 |
| SMe | H | G15 |
| SMe | 4-Me | G15 |
| SMe | 6-Me | G15 |
| SMe | 4-Et | G15 |
| SMe | 4-OMe | G15 |
| SMe | 4-F | G15 |
| SMe | 4-Cl | G15 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G15 |
| CF ₃ | H | G15 |
| CN | H | G15 |
| H | H | G16 |
| H | 3-Me | G16 |
| H | 4-Me | G16 |
| H | 5-Me | G16 |
| H | 6-Me | G16 |
| H | 4-Et | G16 |
| H | 4-t-Bu | G16 |
| H | 4-i-Pr | G16 |
| H | 4-CF ₃ | G16 |
| H | 4-OMe | G16 |
| H | 6-OMe | G16 |
| H | 4-OEt | G16 |
| H | 4-SMe | G16 |
| H | 4-NMe ₂ | G16 |
| H | 3-F | G16 |
| H | 4-F | G16 |
| H | 5-F | G16 |
| H | 6-F | G16 |
| H | 4-Cl | G16 |
| H | 6-Cl | G16 |
| H | 4-Br | G16 |
| H | 4-I | G16 |
| H | 4-CN | G16 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G16 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G16 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G16 |
| Me | H | G16 |
| Me | 3-Me | G16 |
| Me | 4-Me | G16 |
| Me | 5-Me | G16 |
| Me | 6-Me | G16 |
| Me | 3-Et | G16 |
| Me | 4-Et | G16 |
| Me | 5-Et | G16 |
| Me | 6-Et | G16 |
| Me | 4-t-Bu | G16 |
| Me | 4-i-Pr | G16 |
| Me | 3-CF ₃ | G16 |
| Me | 4-CF ₃ | G16 |
| Me | 5-CF ₃ | G16 |
| Me | 6-CF ₃ | G16 |
| Me | 3-OMe | G16 |
| Me | 4-OMe | G16 |
| Me | 5-OMe | G16 |
| Me | 6-OMe | G16 |
| Me | 3-OEt | G16 |

| | | |
|----|-------------------------|-----|
| Me | 4-OEt | G16 |
| Me | 5-OEt | G16 |
| Me | 6-OEt | G16 |
| Me | 3-SMe | G16 |
| Me | 4-SMe | G16 |
| Me | 5-SMe | G16 |
| Me | 6-SMe | G16 |
| Me | 3-NMe ₂ | G16 |
| Me | 4-NMe ₂ | G16 |
| Me | 5-NMe ₂ | G16 |
| Me | 6-NMe ₂ | G16 |
| Me | 3-F | G16 |
| Me | 4-F | G16 |
| Me | 5-F | G16 |
| Me | 6-F | G16 |
| Me | 3-Cl | G16 |
| Me | 4-Cl | G16 |
| Me | 5-Cl | G16 |
| Me | 6-Cl | G16 |
| Me | 3-Br | G16 |
| Me | 4-Br | G16 |
| Me | 5-Br | G16 |
| Me | 6-Br | G16 |
| Me | 3-I | G16 |
| Me | 4-I | G16 |
| Me | 5-I | G16 |
| Me | 6-I | G16 |
| Me | 3-CN | G16 |
| Me | 4-CN | G16 |
| Me | 5-CN | G16 |
| Me | 6-CN | G16 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | G16 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G16 |
| Me | 5, 6-Me ₂ | G16 |
| Me | 4, 5-Cl ₂ | G16 |
| Me | 4, 6-Cl ₂ | G16 |
| Me | 5, 6-Cl ₂ | G16 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | G16 |
| Me | 4, 6-(OMe) ₂ | G16 |
| Me | 5, 6-(OMe) ₂ | G16 |
| Me | 3, 4-F ₂ | G16 |
| Me | 3, 5-F ₂ | G16 |
| Me | 3, 6-F ₂ | G16 |
| Me | 4, 5-F ₂ | G16 |
| Me | 4, 6-F ₂ | G16 |
| Me | 5, 6-F ₂ | G16 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G16 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G16 |
| Me | 4-Me-3-F | G16 |
| Me | 4-Me-5-F | G16 |
| Me | 4-Me-6-F | G16 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G16 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G16 |
| Me | 4-Me-6-Br | G16 |
| Me | 4-Me-6-Et | G16 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G16 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G16 |
| Me | 6-Me-3-F | G16 |

| | | |
|------|---------------------|-----|
| Me | 6-Me-4-F | G16 |
| Me | 6-Me-5-F | G16 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G16 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G16 |
| Me | 6-Me-4-Br | G16 |
| Me | 6-Me-4-Et | G16 |
| Me | 4-OMe-3-F | G16 |
| Me | 4-OMe-5-F | G16 |
| Me | 4-OMe-6-F | G16 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G16 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G16 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G16 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G16 |
| Me | 4-F-5-Cl | G16 |
| Me | 4-F-6-Cl | G16 |
| Me | 4-F-6-Br | G16 |
| Me | 4-F-6-Et | G16 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G16 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G16 |
| Me | 4-Br-6-Et | G16 |
| Et | H | G16 |
| Et | 3-Me | G16 |
| Et | 4-Me | G16 |
| Et | 5-Me | G16 |
| Et | 6-Me | G16 |
| Et | 4-Et | G16 |
| Et | 4-t-Bu | G16 |
| Et | 4-i-Pr | G16 |
| Et | 4-OMe | G16 |
| Et | 6-OMe | G16 |
| Et | 3-F | G16 |
| Et | 4-F | G16 |
| Et | 5-F | G16 |
| Et | 6-F | G16 |
| Et | 4-Cl | G16 |
| Et | 6-Cl | G16 |
| Et | 4-Br | G16 |
| Et | 4,6-Me ₂ | G16 |
| Pr | H | G16 |
| Pr | 4-Me | G16 |
| Pr | 6-Me | G16 |
| Pr | 4-Et | G16 |
| Pr | 4-OMe | G16 |
| Pr | 4-F | G16 |
| Pr | 4-Cl | G16 |
| Pr | 4,6-Me ₂ | G16 |
| i-Pr | H | G16 |
| F | H | G16 |
| F | 4-Me | G16 |
| F | 6-Me | G16 |
| F | 4-Et | G16 |
| F | 4-OMe | G16 |
| F | 4-F | G16 |
| F | 4-Cl | G16 |
| F | 4,6-Me ₂ | G16 |
| Cl | H | G16 |
| Cl | 3-Me | G16 |
| Cl | 4-Me | G16 |

| | | |
|-----------------|---------------------|-----|
| Cl | 5-Me | G16 |
| Cl | 6-Me | G16 |
| Cl | 4-Et | G16 |
| Cl | 4-t-Bu | G16 |
| Cl | 4-i-Pr | G16 |
| Cl | 4-OMe | G16 |
| Cl | 6-OMe | G16 |
| Cl | 3-F | G16 |
| Cl | 4-F | G16 |
| Cl | 5-F | G16 |
| Cl | 6-F | G16 |
| Cl | 4-Cl | G16 |
| Cl | 6-Cl | G16 |
| Cl | 4-Br | G16 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | G16 |
| Br | H | G16 |
| Br | 3-Me | G16 |
| Br | 4-Me | G16 |
| Br | 5-Me | G16 |
| Br | 6-Me | G16 |
| Br | 4-Et | G16 |
| Br | 4-t-Bu | G16 |
| Br | 4-i-Pr | G16 |
| Br | 4-OMe | G16 |
| Br | 6-OMe | G16 |
| Br | 3-F | G16 |
| Br | 4-F | G16 |
| Br | 5-F | G16 |
| Br | 6-F | G16 |
| Br | 4-Cl | G16 |
| Br | 6-Cl | G16 |
| Br | 4-Br | G16 |
| Br | 4,6-Me ₂ | G16 |
| OMe | H | G16 |
| SMe | H | G16 |
| SMe | 4-Me | G16 |
| SMe | 6-Me | G16 |
| SMe | 4-Et | G16 |
| SMe | 4-OMe | G16 |
| SMe | 4-F | G16 |
| SMe | 4-Cl | G16 |
| SMe | 4,6-Me ₂ | G16 |
| CF ₃ | H | G16 |
| CN | H | G16 |
| H | H | G17 |
| H | 3-Me | G17 |
| H | 4-Me | G17 |
| H | 5-Me | G17 |
| H | 6-Me | G17 |
| H | 4-Et | G17 |
| H | 4-t-Bu | G17 |
| H | 4-i-Pr | G17 |
| H | 4-CF ₃ | G17 |
| H | 4-OMe | G17 |
| H | 6-OMe | G17 |
| H | 4-OEt | G17 |
| H | 4-SMe | G17 |
| H | 4-NMe ₂ | G17 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| H | 3-F | G17 |
| H | 4-F | G17 |
| H | 5-F | G17 |
| H | 6-F | G17 |
| H | 4-Cl | G17 |
| H | 6-Cl | G17 |
| H | 4-Br | G17 |
| H | 4-I | G17 |
| H | 4-CN | G17 |
| H | 4,5-Me ₂ | G17 |
| H | 4,6-Me ₂ | G17 |
| H | 4,5-(OMe) ₂ | G17 |
| Me | H | G17 |
| Me | 3-Me | G17 |
| Me | 4-Me | G17 |
| Me | 5-Me | G17 |
| Me | 6-Me | G17 |
| Me | 3-Et | G17 |
| Me | 4-Et | G17 |
| Me | 5-Et | G17 |
| Me | 6-Et | G17 |
| Me | 4-t-Bu | G17 |
| Me | 4-i-Pr | G17 |
| Me | 3-CF ₃ | G17 |
| Me | 4-CF ₃ | G17 |
| Me | 5-CF ₃ | G17 |
| Me | 6-CF ₃ | G17 |
| Me | 3-OMe | G17 |
| Me | 4-OMe | G17 |
| Me | 5-OMe | G17 |
| Me | 6-OMe | G17 |
| Me | 3-OEt | G17 |
| Me | 4-OEt | G17 |
| Me | 5-OEt | G17 |
| Me | 6-OEt | G17 |
| Me | 3-SMe | G17 |
| Me | 4-SMe | G17 |
| Me | 5-SMe | G17 |
| Me | 6-SMe | G17 |
| Me | 3-NMe ₂ | G17 |
| Me | 4-NMe ₂ | G17 |
| Me | 5-NMe ₂ | G17 |
| Me | 6-NMe ₂ | G17 |
| Me | 3-F | G17 |
| Me | 4-F | G17 |
| Me | 5-F | G17 |
| Me | 6-F | G17 |
| Me | 3-Cl | G17 |
| Me | 4-Cl | G17 |
| Me | 5-Cl | G17 |
| Me | 6-Cl | G17 |
| Me | 3-Br | G17 |
| Me | 4-Br | G17 |
| Me | 5-Br | G17 |
| Me | 6-Br | G17 |
| Me | 3-I | G17 |
| Me | 4-I | G17 |
| Me | 5-I | G17 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| Me | 6-I | G17 |
| Me | 3-CN | G17 |
| Me | 4-CN | G17 |
| Me | 5-CN | G17 |
| Me | 6-CN | G17 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G17 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G17 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G17 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G17 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G17 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G17 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G17 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G17 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G17 |
| Me | 3,4-F ₂ | G17 |
| Me | 3,5-F ₂ | G17 |
| Me | 3,6-F ₂ | G17 |
| Me | 4,5-F ₂ | G17 |
| Me | 4,6-F ₂ | G17 |
| Me | 5,6-F ₂ | G17 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G17 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G17 |
| Me | 4-Me-3-F | G17 |
| Me | 4-Me-5-F | G17 |
| Me | 4-Me-6-F | G17 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G17 |
| Me | 4-Me-6-Cl | G17 |
| Me | 4-Me-6-Br | G17 |
| Me | 4-Me-6-Et | G17 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G17 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G17 |
| Me | 6-Me-3-F | G17 |
| Me | 6-Me-4-F | G17 |
| Me | 6-Me-5-F | G17 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G17 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G17 |
| Me | 6-Me-4-Br | G17 |
| Me | 6-Me-4-Et | G17 |
| Me | 4-OMe-3-F | G17 |
| Me | 4-OMe-5-F | G17 |
| Me | 4-OMe-6-F | G17 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G17 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G17 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G17 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G17 |
| Me | 4-F-5-Cl | G17 |
| Me | 4-F-6-Cl | G17 |
| Me | 4-F-6-Br | G17 |
| Me | 4-F-6-Et | G17 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G17 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G17 |
| Me | 4-Br-6-Et | G17 |
| Et | H | G17 |
| Et | 3-Me | G17 |
| Et | 4-Me | G17 |
| Et | 5-Me | G17 |
| Et | 6-Me | G17 |
| Et | 4-Et | G17 |

| | | |
|------|---------------------|-----|
| Et | 4-t-Bu | G17 |
| Et | 4-i-Pr | G17 |
| Et | 4-OMe | G17 |
| Et | 6-OMe | G17 |
| Et | 3-F | G17 |
| Et | 4-F | G17 |
| Et | 5-F | G17 |
| Et | 6-F | G17 |
| Et | 4-Cl | G17 |
| Et | 6-Cl | G17 |
| Et | 4-Br | G17 |
| Et | 4,6-Me ₂ | G17 |
| Pr | H | G17 |
| Pr | 4-Me | G17 |
| Pr | 6-Me | G17 |
| Pr | 4-Et | G17 |
| Pr | 4-OMe | G17 |
| Pr | 4-F | G17 |
| Pr | 4-Cl | G17 |
| Pr | 4,6-Me ₂ | G17 |
| i-Pr | H | G17 |
| F | H | G17 |
| F | 4-Me | G17 |
| F | 6-Me | G17 |
| F | 4-Et | G17 |
| F | 4-OMe | G17 |
| F | 4-F | G17 |
| F | 4-Cl | G17 |
| F | 4,6-Me ₂ | G17 |
| Cl | H | G17 |
| Cl | 3-Me | G17 |
| Cl | 4-Me | G17 |
| Cl | 5-Me | G17 |
| Cl | 6-Me | G17 |
| Cl | 4-Et | G17 |
| Cl | 4-t-Bu | G17 |
| Cl | 4-i-Pr | G17 |
| Cl | 4-OMe | G17 |
| Cl | 6-OMe | G17 |
| Cl | 3-F | G17 |
| Cl | 4-F | G17 |
| Cl | 5-F | G17 |
| Cl | 6-F | G17 |
| Cl | 4-Cl | G17 |
| Cl | 6-Cl | G17 |
| Cl | 4-Br | G17 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | G17 |
| Br | H | G17 |
| Br | 3-Me | G17 |
| Br | 4-Me | G17 |
| Br | 5-Me | G17 |
| Br | 6-Me | G17 |
| Br | 4-Et | G17 |
| Br | 4-t-Bu | G17 |
| Br | 4-i-Pr | G17 |
| Br | 4-OMe | G17 |
| Br | 6-OMe | G17 |
| Br | 3-F | G17 |

| | | |
|-----------------|-------------------------|-----|
| Br | 4-F | G17 |
| Br | 5-F | G17 |
| Br | 6-F | G17 |
| Br | 4-Cl | G17 |
| Br | 6-Cl | G17 |
| Br | 4-Br | G17 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | G17 |
| OMe | H | G17 |
| SMe | H | G17 |
| SMe | 4-Me | G17 |
| SMe | 6-Me | G17 |
| SMe | 4-Et | G17 |
| SMe | 4-OMe | G17 |
| SMe | 4-F | G17 |
| SMe | 4-Cl | G17 |
| SMe | 4, 6-Me ₂ | G17 |
| CF ₃ | H | G17 |
| CN | H | G17 |
| H | H | G18 |
| H | 3-Me | G18 |
| H | 4-Me | G18 |
| H | 5-Me | G18 |
| H | 6-Me | G18 |
| H | 4-Et | G18 |
| H | 4-t-Bu | G18 |
| H | 4-i-Pr | G18 |
| H | 4-CF ₃ | G18 |
| H | 4-OMe | G18 |
| H | 6-OMe | G18 |
| H | 4-OEt | G18 |
| H | 4-SMe | G18 |
| H | 4-NMe ₂ | G18 |
| H | 3-F | G18 |
| H | 4-F | G18 |
| H | 5-F | G18 |
| H | 6-F | G18 |
| H | 4-Cl | G18 |
| H | 6-Cl | G18 |
| H | 4-Br | G18 |
| H | 4-I | G18 |
| H | 4-CN | G18 |
| H | 4, 5-Me ₂ | G18 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G18 |
| H | 4, 5-(OMe) ₂ | G18 |
| Me | H | G18 |
| Me | 3-Me | G18 |
| Me | 4-Me | G18 |
| Me | 5-Me | G18 |
| Me | 6-Me | G18 |
| Me | 3-Et | G18 |
| Me | 4-Et | G18 |
| Me | 5-Et | G18 |
| Me | 6-Et | G18 |
| Me | 4-t-Bu | G18 |
| Me | 4-i-Pr | G18 |
| Me | 3-CF ₃ | G18 |
| Me | 4-CF ₃ | G18 |
| Me | 5-CF ₃ | G18 |

| | | |
|----|------------------------|-----|
| Me | 6-CF ₃ | G18 |
| Me | 3-OMe | G18 |
| Me | 4-OMe | G18 |
| Me | 5-OMe | G18 |
| Me | 6-OMe | G18 |
| Me | 3-OEt | G18 |
| Me | 4-OEt | G18 |
| Me | 5-OEt | G18 |
| Me | 6-OEt | G18 |
| Me | 3-SMe | G18 |
| Me | 4-SMe | G18 |
| Me | 5-SMe | G18 |
| Me | 6-SMe | G18 |
| Me | 3-NMe ₂ | G18 |
| Me | 4-NMe ₂ | G18 |
| Me | 5-NMe ₂ | G18 |
| Me | 6-NMe ₂ | G18 |
| Me | 3-F | G18 |
| Me | 4-F | G18 |
| Me | 5-F | G18 |
| Me | 6-F | G18 |
| Me | 3-Cl | G18 |
| Me | 4-Cl | G18 |
| Me | 5-Cl | G18 |
| Me | 6-Cl | G18 |
| Me | 3-Br | G18 |
| Me | 4-Br | G18 |
| Me | 5-Br | G18 |
| Me | 6-Br | G18 |
| Me | 3-I | G18 |
| Me | 4-I | G18 |
| Me | 5-I | G18 |
| Me | 6-I | G18 |
| Me | 3-CN | G18 |
| Me | 4-CN | G18 |
| Me | 5-CN | G18 |
| Me | 6-CN | G18 |
| Me | 4,5-Me ₂ | G18 |
| Me | 4,6-Me ₂ | G18 |
| Me | 5,6-Me ₂ | G18 |
| Me | 4,5-Cl ₂ | G18 |
| Me | 4,6-Cl ₂ | G18 |
| Me | 5,6-Cl ₂ | G18 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | G18 |
| Me | 4,6-(OMe) ₂ | G18 |
| Me | 5,6-(OMe) ₂ | G18 |
| Me | 3,4-F ₂ | G18 |
| Me | 3,5-F ₂ | G18 |
| Me | 3,6-F ₂ | G18 |
| Me | 4,5-F ₂ | G18 |
| Me | 4,6-F ₂ | G18 |
| Me | 5,6-F ₂ | G18 |
| Me | 4-Me-5-OMe | G18 |
| Me | 4-Me-6-OMe | G18 |
| Me | 4-Me-3-F | G18 |
| Me | 4-Me-5-F | G18 |
| Me | 4-Me-6-F | G18 |
| Me | 4-Me-5-Cl | G18 |

| | | |
|------|----------------------|-----|
| Me | 4-Me-6-Cl | G18 |
| Me | 4-Me-6-Br | G18 |
| Me | 4-Me-6-Et | G18 |
| Me | 6-Me-4-OMe | G18 |
| Me | 6-Me-5-OMe | G18 |
| Me | 6-Me-3-F | G18 |
| Me | 6-Me-4-F | G18 |
| Me | 6-Me-5-F | G18 |
| Me | 6-Me-4-Cl | G18 |
| Me | 6-Me-5-Cl | G18 |
| Me | 6-Me-4-Br | G18 |
| Me | 6-Me-4-Et | G18 |
| Me | 4-OMe-3-F | G18 |
| Me | 4-OMe-5-F | G18 |
| Me | 4-OMe-6-F | G18 |
| Me | 4-OMe-5-Cl | G18 |
| Me | 4-OMe-6-Cl | G18 |
| Me | 4-OMe-6-Br | G18 |
| Me | 4-OMe-6-Et | G18 |
| Me | 4-F-5-Cl | G18 |
| Me | 4-F-6-Cl | G18 |
| Me | 4-F-6-Br | G18 |
| Me | 4-F-6-Et | G18 |
| Me | 4-Cl-6-Br | G18 |
| Me | 4-Cl-6-Et | G18 |
| Me | 4-Br-6-Et | G18 |
| Et | H | G18 |
| Et | 3-Me | G18 |
| Et | 4-Me | G18 |
| Et | 5-Me | G18 |
| Et | 6-Me | G18 |
| Et | 4-Et | G18 |
| Et | 4-t-Bu | G18 |
| Et | 4-i-Pr | G18 |
| Et | 4-OMe | G18 |
| Et | 6-OMe | G18 |
| Et | 3-F | G18 |
| Et | 4-F | G18 |
| Et | 5-F | G18 |
| Et | 6-F | G18 |
| Et | 4-Cl | G18 |
| Et | 6-Cl | G18 |
| Et | 4-Br | G18 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G18 |
| Pr | H | G18 |
| Pr | 4-Me | G18 |
| Pr | 6-Me | G18 |
| Pr | 4-Et | G18 |
| Pr | 4-OMe | G18 |
| Pr | 4-F | G18 |
| Pr | 4-Cl | G18 |
| Pr | 4, 6-Me ₂ | G18 |
| i-Pr | H | G18 |
| F | H | G18 |
| F | 4-Me | G18 |
| F | 6-Me | G18 |
| F | 4-Et | G18 |
| F | 4-OMe | G18 |

| | | |
|-----------------|---------------------|-----|
| F | 4-F | G18 |
| F | 4-Cl | G18 |
| F | 4,6-Me ₂ | G18 |
| Cl | H | G18 |
| Cl | 3-Me | G18 |
| Cl | 4-Me | G18 |
| Cl | 5-Me | G18 |
| Cl | 6-Me | G18 |
| Cl | 4-Et | G18 |
| Cl | 4-t-Bu | G18 |
| Cl | 4-i-Pr | G18 |
| Cl | 4-OMe | G18 |
| Cl | 6-OMe | G18 |
| Cl | 3-F | G18 |
| Cl | 4-F | G18 |
| Cl | 5-F | G18 |
| Cl | 6-F | G18 |
| Cl | 4-Cl | G18 |
| Cl | 6-Cl | G18 |
| Cl | 4-Br | G18 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | G18 |
| Br | H | G18 |
| Br | 3-Me | G18 |
| Br | 4-Me | G18 |
| Br | 5-Me | G18 |
| Br | 6-Me | G18 |
| Br | 4-Et | G18 |
| Br | 4-t-Bu | G18 |
| Br | 4-i-Pr | G18 |
| Br | 4-OMe | G18 |
| Br | 6-OMe | G18 |
| Br | 3-F | G18 |
| Br | 4-F | G18 |
| Br | 5-F | G18 |
| Br | 6-F | G18 |
| Br | 4-Cl | G18 |
| Br | 6-Cl | G18 |
| Br | 4-Br | G18 |
| Br | 4,6-Me ₂ | G18 |
| OMe | H | G18 |
| SMe | H | G18 |
| SMe | 4-Me | G18 |
| SMe | 6-Me | G18 |
| SMe | 4-Et | G18 |
| SMe | 4-OMe | G18 |
| SMe | 4-F | G18 |
| SMe | 4-Cl | G18 |
| SMe | 4,6-Me ₂ | G18 |
| CF ₃ | H | G18 |
| CN | H | G18 |
| H | H | G19 |
| H | 4-Me | G19 |
| H | 6-Me | G19 |
| H | 4-Et | G19 |
| H | 4-OMe | G19 |
| H | 4-F | G19 |
| H | 4-Cl | G19 |
| H | 4,6-Me ₂ | G19 |

| | | |
|----|----------------------|-----|
| Me | H | G19 |
| Me | 4-Me | G19 |
| Me | 6-Me | G19 |
| Me | 4-Et | G19 |
| Me | 4-OMe | G19 |
| Me | 4-F | G19 |
| Me | 4-Cl | G19 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G19 |
| Et | H | G19 |
| Et | 4-Me | G19 |
| Et | 6-Me | G19 |
| Et | 4-Et | G19 |
| Et | 4-OMe | G19 |
| Et | 4-F | G19 |
| Et | 4-Cl | G19 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G19 |
| H | H | G20 |
| H | 4-Me | G20 |
| H | 6-Me | G20 |
| H | 4-Et | G20 |
| H | 4-OMe | G20 |
| H | 4-F | G20 |
| H | 4-Cl | G20 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G20 |
| Me | H | G20 |
| Me | 4-Me | G20 |
| Me | 6-Me | G20 |
| Me | 4-Et | G20 |
| Me | 4-OMe | G20 |
| Me | 4-F | G20 |
| Me | 4-Cl | G20 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G20 |
| Et | H | G20 |
| Et | 4-Me | G20 |
| Et | 6-Me | G20 |
| Et | 4-Et | G20 |
| Et | 4-OMe | G20 |
| Et | 4-F | G20 |
| Et | 4-Cl | G20 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G20 |
| H | H | G21 |
| H | 4-Me | G21 |
| H | 6-Me | G21 |
| H | 4-Et | G21 |
| H | 4-OMe | G21 |
| H | 4-F | G21 |
| H | 4-Cl | G21 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G21 |
| Me | H | G21 |
| Me | 4-Me | G21 |
| Me | 6-Me | G21 |
| Me | 4-Et | G21 |
| Me | 4-OMe | G21 |
| Me | 4-F | G21 |
| Me | 4-Cl | G21 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G21 |
| Et | H | G21 |
| Et | 4-Me | G21 |

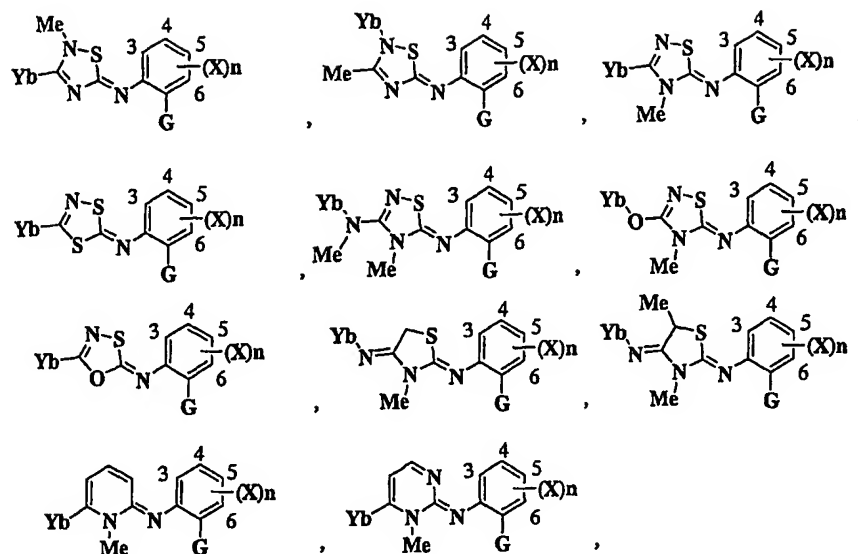
| | | |
|----|----------------------|-----|
| Et | 6-Me | G21 |
| Et | 4-Et | G21 |
| Et | 4-OMe | G21 |
| Et | 4-F | G21 |
| Et | 4-Cl | G21 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G21 |
| H | H | G22 |
| H | 4-Me | G22 |
| H | 6-Me | G22 |
| H | 4-Et | G22 |
| H | 4-OMe | G22 |
| H | 4-F | G22 |
| H | 4-Cl | G22 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G22 |
| Me | H | G22 |
| Me | 4-Me | G22 |
| Me | 6-Me | G22 |
| Me | 4-Et | G22 |
| Me | 4-OMe | G22 |
| Me | 4-F | G22 |
| Me | 4-Cl | G22 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G22 |
| Et | H | G22 |
| Et | 4-Me | G22 |
| Et | 6-Me | G22 |
| Et | 4-Et | G22 |
| Et | 4-OMe | G22 |
| Et | 4-F | G22 |
| Et | 4-Cl | G22 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G22 |
| H | H | G23 |
| H | 4-Me | G23 |
| H | 6-Me | G23 |
| H | 4-Et | G23 |
| H | 4-OMe | G23 |
| H | 4-F | G23 |
| H | 4-Cl | G23 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G23 |
| Me | H | G23 |
| Me | 4-Me | G23 |
| Me | 6-Me | G23 |
| Me | 4-Et | G23 |
| Me | 4-OMe | G23 |
| Me | 4-F | G23 |
| Me | 4-Cl | G23 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G23 |
| Et | H | G23 |
| Et | 4-Me | G23 |
| Et | 6-Me | G23 |
| Et | 4-Et | G23 |
| Et | 4-OMe | G23 |
| Et | 4-F | G23 |
| Et | 4-Cl | G23 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G23 |
| H | H | G24 |
| H | 4-Me | G24 |
| H | 6-Me | G24 |
| H | 4-Et | G24 |

| | | |
|----|----------------------|-----|
| H | 4-OMe | G24 |
| H | 4-F | G24 |
| H | 4-Cl | G24 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G24 |
| Me | H | G24 |
| Me | 4-Me | G24 |
| Me | 6-Me | G24 |
| Me | 4-Et | G24 |
| Me | 4-OMe | G24 |
| Me | 4-F | G24 |
| Me | 4-Cl | G24 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G24 |
| Et | H | G24 |
| Et | 4-Me | G24 |
| Et | 6-Me | G24 |
| Et | 4-Et | G24 |
| Et | 4-OMe | G24 |
| Et | 4-F | G24 |
| Et | 4-Cl | G24 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G24 |
| H | H | G25 |
| H | 4-Me | G25 |
| H | 6-Me | G25 |
| H | 4-Et | G25 |
| H | 4-OMe | G25 |
| H | 4-F | G25 |
| H | 4-Cl | G25 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G25 |
| Me | H | G25 |
| Me | 4-Me | G25 |
| Me | 6-Me | G25 |
| Me | 4-Et | G25 |
| Me | 4-OMe | G25 |
| Me | 4-F | G25 |
| Me | 4-Cl | G25 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G25 |
| Et | H | G25 |
| Et | 4-Me | G25 |
| Et | 6-Me | G25 |
| Et | 4-Et | G25 |
| Et | 4-OMe | G25 |
| Et | 4-F | G25 |
| Et | 4-Cl | G25 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G25 |
| H | H | G26 |
| H | 4-Me | G26 |
| H | 6-Me | G26 |
| H | 4-Et | G26 |
| H | 4-OMe | G26 |
| H | 4-F | G26 |
| H | 4-Cl | G26 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G26 |
| Me | H | G26 |
| Me | 4-Me | G26 |
| Me | 6-Me | G26 |
| Me | 4-Et | G26 |
| Me | 4-OMe | G26 |
| Me | 4-F | G26 |

| | | |
|----|----------------------|-----|
| Me | 4-Cl | G26 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G26 |
| Et | H | G26 |
| Et | 4-Me | G26 |
| Et | 6-Me | G26 |
| Et | 4-Et | G26 |
| Et | 4-OMe | G26 |
| Et | 4-F | G26 |
| Et | 4-Cl | G26 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G26 |
| H | H | G27 |
| H | 4-Me | G27 |
| H | 6-Me | G27 |
| H | 4-Et | G27 |
| H | 4-OMe | G27 |
| H | 4-F | G27 |
| H | 4-Cl | G27 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G27 |
| Me | H | G27 |
| Me | 4-Me | G27 |
| Me | 6-Me | G27 |
| Me | 4-Et | G27 |
| Me | 4-OMe | G27 |
| Me | 4-F | G27 |
| Me | 4-Cl | G27 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G27 |
| Et | H | G27 |
| Et | 4-Me | G27 |
| Et | 6-Me | G27 |
| Et | 4-Et | G27 |
| Et | 4-OMe | G27 |
| Et | 4-F | G27 |
| Et | 4-Cl | G27 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G27 |
| H | H | G28 |
| H | 4-Me | G28 |
| H | 6-Me | G28 |
| H | 4-Et | G28 |
| H | 4-OMe | G28 |
| H | 4-F | G28 |
| H | 4-Cl | G28 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G28 |
| Me | H | G28 |
| Me | 4-Me | G28 |
| Me | 6-Me | G28 |
| Me | 4-Et | G28 |
| Me | 4-OMe | G28 |
| Me | 4-F | G28 |
| Me | 4-Cl | G28 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G28 |
| Et | H | G28 |
| Et | 4-Me | G28 |
| Et | 6-Me | G28 |
| Et | 4-Et | G28 |
| Et | 4-OMe | G28 |
| Et | 4-F | G28 |
| Et | 4-Cl | G28 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G28 |

| | | |
|----|----------------------|-----|
| H | H | G29 |
| H | 4-Me | G29 |
| H | 6-Me | G29 |
| H | 4-Et | G29 |
| H | 4-OMe | G29 |
| H | 4-F | G29 |
| H | 4-Cl | G29 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G29 |
| Me | H | G29 |
| Me | 4-Me | G29 |
| Me | 6-Me | G29 |
| Me | 4-Et | G29 |
| Me | 4-OMe | G29 |
| Me | 4-F | G29 |
| Me | 4-Cl | G29 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G29 |
| Et | H | G29 |
| Et | 4-Me | G29 |
| Et | 6-Me | G29 |
| Et | 4-Et | G29 |
| Et | 4-OMe | G29 |
| Et | 4-F | G29 |
| Et | 4-Cl | G29 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G29 |
| H | H | G30 |
| H | 4-Me | G30 |
| H | 6-Me | G30 |
| H | 4-Et | G30 |
| H | 4-OMe | G30 |
| H | 4-F | G30 |
| H | 4-Cl | G30 |
| H | 4, 6-Me ₂ | G30 |
| Me | H | G30 |
| Me | 4-Me | G30 |
| Me | 6-Me | G30 |
| Me | 4-Et | G30 |
| Me | 4-OMe | G30 |
| Me | 4-F | G30 |
| Me | 4-Cl | G30 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | G30 |
| Et | H | G30 |
| Et | 4-Me | G30 |
| Et | 6-Me | G30 |
| Et | 4-Et | G30 |
| Et | 4-OMe | G30 |
| Et | 4-F | G30 |
| Et | 4-Cl | G30 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | G30 |

[第 2 表]



| Y b | X n | G |
|---|-----|----|
| 4-CF ₃ -Ph | H | G1 |
| 4-Me-Ph | H | G1 |
| 4-Cl-Ph | H | G1 |
| 4-t-Bu-Ph | H | G1 |
| 4-F-Ph | H | G1 |
| 3-Me-Ph | H | G1 |
| 3-Cl-Ph | H | G1 |
| 3-CF ₃ O-Ph | H | G1 |
| 3-Br-Ph | H | G1 |
| 2-Cl-Ph | H | G1 |
| 2-F-Ph | H | G1 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | H | G1 |
| 2,4-F ₂ -Ph | H | G1 |
| 2,6-F ₂ -Ph | H | G1 |
| 3,4-F ₂ -Ph | H | G1 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | H | G1 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | H | G1 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | H | G1 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | H | G1 |
| 5-Cl-2-pyridyl | H | G1 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | H | G1 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | H | G1 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | H | G1 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | H | G1 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-(F ₂ HC)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-(F ₂ HCCCH ₂)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | H | G1 |

| | | |
|---|------|----|
| 1-Pr-4-pyrazolyl | H | G1 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | H | G1 |
| 4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G1 |
| 4-Me-Ph | 4-Me | G1 |
| 4-Cl-Ph | 4-Me | G1 |
| 4-t-Bu-Ph | 4-Me | G1 |
| 4-F-Ph | 4-Me | G1 |
| 3-Me-Ph | 4-Me | G1 |
| 3-Cl-Ph | 4-Me | G1 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 4-Me | G1 |
| 3-Br-Ph | 4-Me | G1 |
| 2-Cl-Ph | 4-Me | G1 |
| 2-F-Ph | 4-Me | G1 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-Me | G1 |
| 2,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G1 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 4-Me | G1 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G1 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 4-Me | G1 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G1 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 4-Me | G1 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G1 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 4-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 4-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G1 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 4-Me | G1 |
| 4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G1 |
| 4-Me-Ph | 6-Me | G1 |
| 4-Cl-Ph | 6-Me | G1 |
| 4-t-Bu-Ph | 6-Me | G1 |
| 4-F-Ph | 6-Me | G1 |
| 3-Me-Ph | 6-Me | G1 |
| 3-Cl-Ph | 6-Me | G1 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 6-Me | G1 |
| 3-Br-Ph | 6-Me | G1 |
| 2-Cl-Ph | 6-Me | G1 |
| 2-F-Ph | 6-Me | G1 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 6-Me | G1 |
| 2,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G1 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 6-Me | G1 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G1 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 6-Me | G1 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G1 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 6-Me | G1 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G1 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 6-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 6-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G1 |

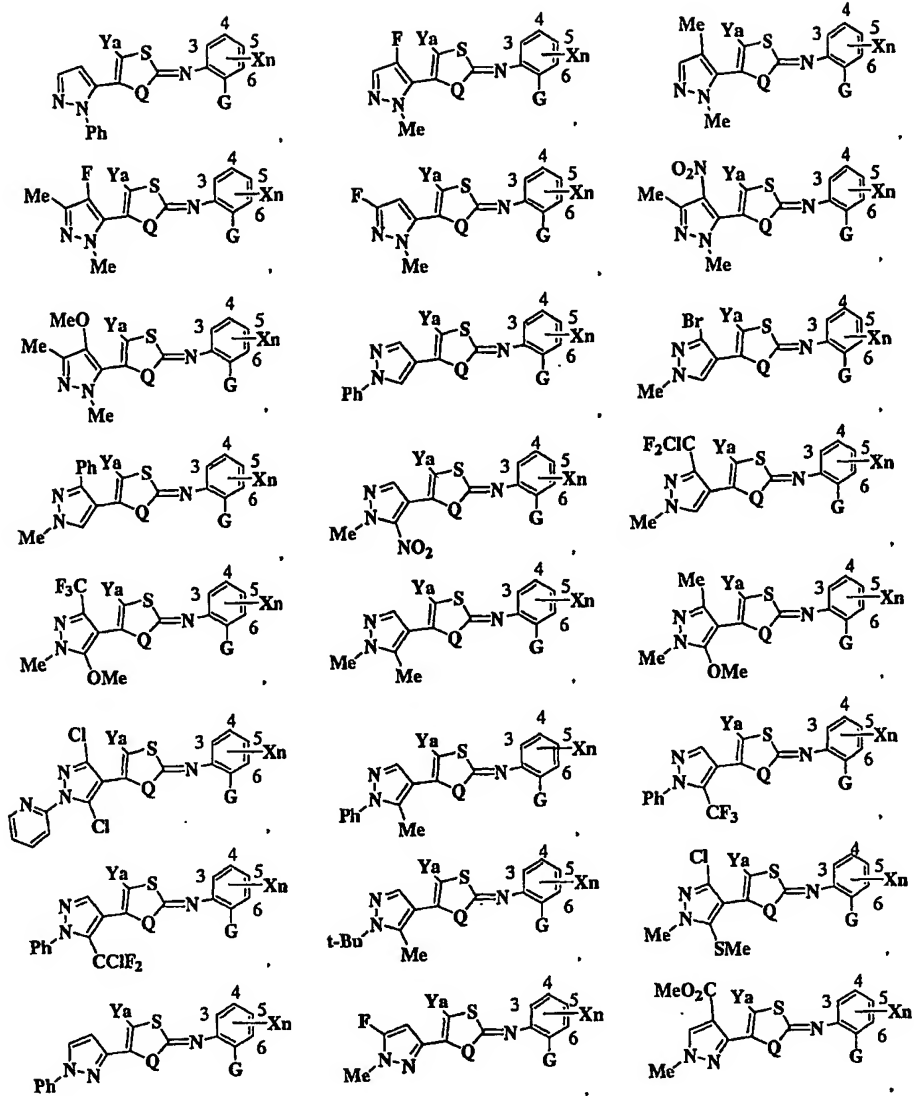
| | | |
|--|------|-----|
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G1 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-(F ₂ HCCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 6-Me | G1 |
| 4-CF ₃ -Ph | H | G11 |
| 4-Me-Ph | H | G11 |
| 4-Cl-Ph | H | G11 |
| 4-t-Bu-Ph | H | G11 |
| 4-F-Ph | H | G11 |
| 3-Me-Ph | H | G11 |
| 3-Cl-Ph | H | G11 |
| 3-CF ₃ O-Ph | H | G11 |
| 3-Br-Ph | H | G11 |
| 2-Cl-Ph | H | G11 |
| 2-F-Ph | H | G11 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | H | G11 |
| 2,4-F ₂ -Ph | H | G11 |
| 2,6-F ₂ -Ph | H | G11 |
| 3,4-F ₂ -Ph | H | G11 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | H | G11 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | H | G11 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | H | G11 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | H | G11 |
| 5-Cl-2-pyridyl | H | G11 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | H | G11 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | H | G11 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | H | G11 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | H | G11 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-(F ₂ HCCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | H | G11 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | H | G11 |
| 4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G11 |
| 4-Me-Ph | 4-Me | G11 |
| 4-Cl-Ph | 4-Me | G11 |
| 4-t-Bu-Ph | 4-Me | G11 |
| 4-F-Ph | 4-Me | G11 |
| 3-Me-Ph | 4-Me | G11 |
| 3-Cl-Ph | 4-Me | G11 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 4-Me | G11 |
| 3-Br-Ph | 4-Me | G11 |
| 2-Cl-Ph | 4-Me | G11 |
| 2-F-Ph | 4-Me | G11 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-Me | G11 |

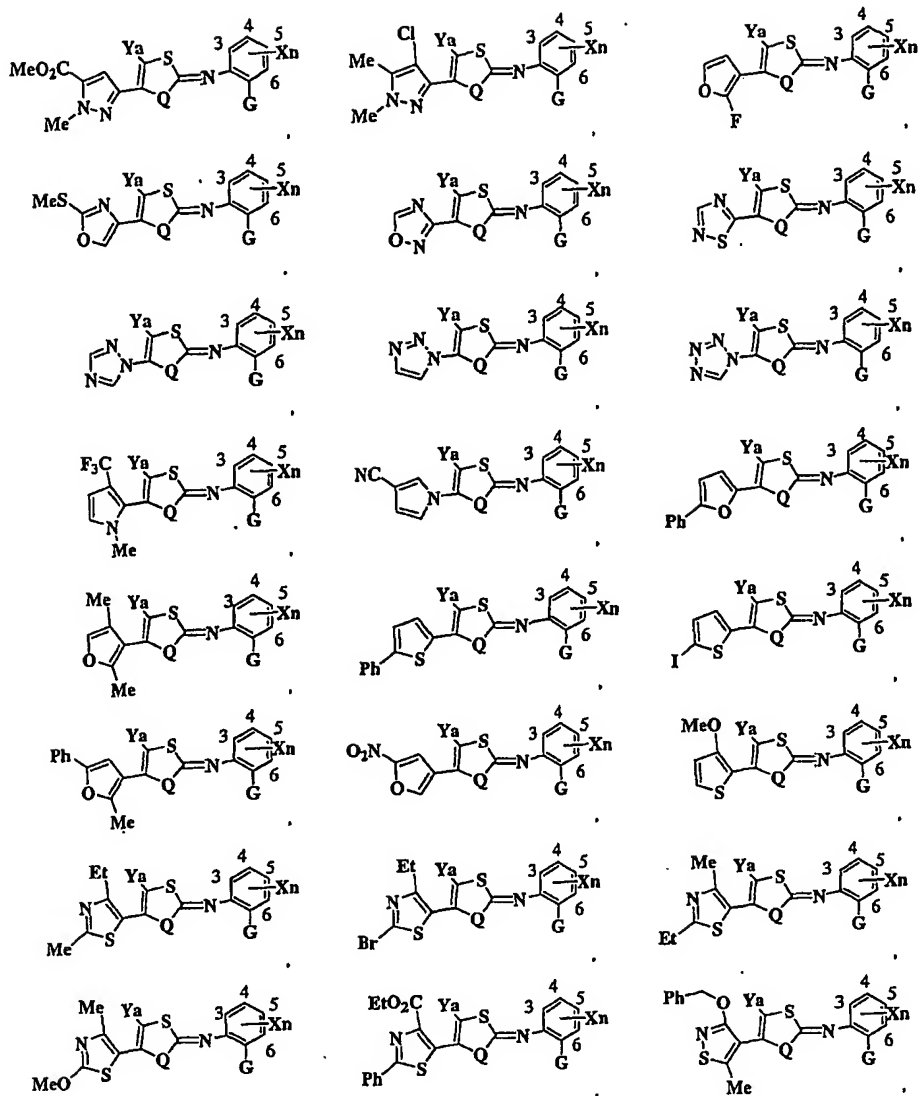
| | | |
|---|------|-----|
| 2,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G11 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 4-Me | G11 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G11 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 4-Me | G11 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G11 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 4-Me | G11 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G11 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 4-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 4-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G11 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 4-Me | G11 |
| 4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G11 |
| 4-Me-Ph | 6-Me | G11 |
| 4-Cl-Ph | 6-Me | G11 |
| 4-t-Bu-Ph | 6-Me | G11 |
| 4-F-Ph | 6-Me | G11 |
| 3-Me-Ph | 6-Me | G11 |
| 3-Cl-Ph | 6-Me | G11 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 6-Me | G11 |
| 3-Br-Ph | 6-Me | G11 |
| 2-Cl-Ph | 6-Me | G11 |
| 2-F-Ph | 6-Me | G11 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 6-Me | G11 |
| 2,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G11 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 6-Me | G11 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G11 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 6-Me | G11 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G11 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 6-Me | G11 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G11 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 6-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 6-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G11 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G11 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 6-Me | G11 |
| 4-CF ₃ -Ph | H | G13 |
| 4-Me-Ph | H | G13 |

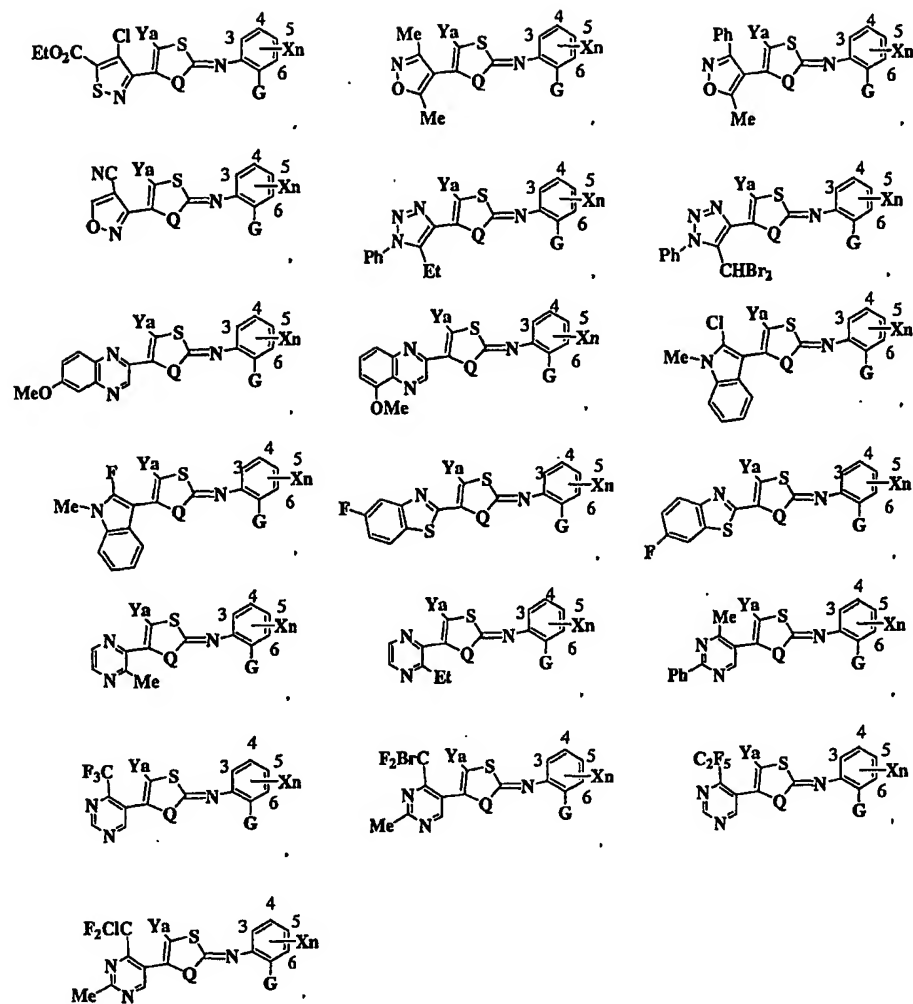
| | | |
|---|------|-----|
| 4-Cl-Ph | H | G13 |
| 4-t-Bu-Ph | H | G13 |
| 4-F-Ph | H | G13 |
| 3-Me-Ph | H | G13 |
| 3-Cl-Ph | H | G13 |
| 3-CF ₃ O-Ph | H | G13 |
| 3-Br-Ph | H | G13 |
| 2-Cl-Ph | H | G13 |
| 2-F-Ph | H | G13 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | H | G13 |
| 2,4-F ₂ -Ph | H | G13 |
| 2,6-F ₂ -Ph | H | G13 |
| 3,4-F ₂ -Ph | H | G13 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | H | G13 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | H | G13 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | H | G13 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | H | G13 |
| 5-Cl-2-pyridyl | H | G13 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | H | G13 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | H | G13 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | H | G13 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | H | G13 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | H | G13 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | H | G13 |
| 4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G13 |
| 4-Me-Ph | 4-Me | G13 |
| 4-Cl-Ph | 4-Me | G13 |
| 4-t-Bu-Ph | 4-Me | G13 |
| 4-F-Ph | 4-Me | G13 |
| 3-Me-Ph | 4-Me | G13 |
| 3-Cl-Ph | 4-Me | G13 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 4-Me | G13 |
| 3-Br-Ph | 4-Me | G13 |
| 2-Cl-Ph | 4-Me | G13 |
| 2-F-Ph | 4-Me | G13 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-Me | G13 |
| 2,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G13 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 4-Me | G13 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 4-Me | G13 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 4-Me | G13 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G13 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 4-Me | G13 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 4-Me | G13 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 4-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 4-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G13 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 4-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |

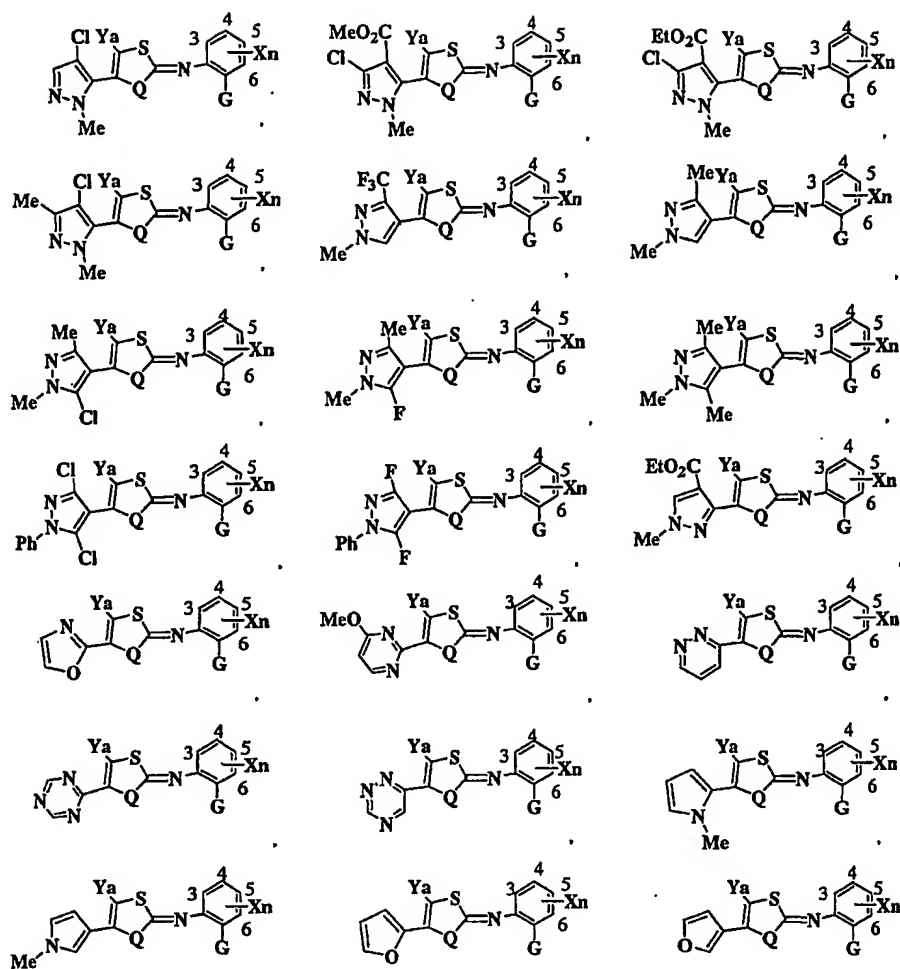
| | | |
|---|------|-----|
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 4-Me | G13 |
| 4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G13 |
| 4-Me-Ph | 6-Me | G13 |
| 4-Cl-Ph | 6-Me | G13 |
| 4-t-Bu-Ph | 6-Me | G13 |
| 4-F-Ph | 6-Me | G13 |
| 3-Me-Ph | 6-Me | G13 |
| 3-Cl-Ph | 6-Me | G13 |
| 3-CF ₃ O-Ph | 6-Me | G13 |
| 3-Br-Ph | 6-Me | G13 |
| 2-Cl-Ph | 6-Me | G13 |
| 2-F-Ph | 6-Me | G13 |
| 2,4-Cl ₂ -Ph | 6-Me | G13 |
| 2,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G13 |
| 2,6-F ₂ -Ph | 6-Me | G13 |
| 3,4-F ₂ -Ph | 6-Me | G13 |
| 4-F-3-CF ₃ -Ph | 6-Me | G13 |
| 3-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G13 |
| 2-F-5-CF ₃ -Ph | 6-Me | G13 |
| 2-F-4-CF ₃ -Ph | 6-Me | G13 |
| 5-Cl-2-pyridyl | 6-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -2-pyridyl | 6-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G13 |
| 4-CF ₃ -2-thienyl | 6-Me | G13 |
| 5-CF ₃ -3-isoxazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Me-4-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Et-4-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-Pr-4-pyrazolyl | 6-Me | G13 |
| 1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl | 6-Me | G13 |

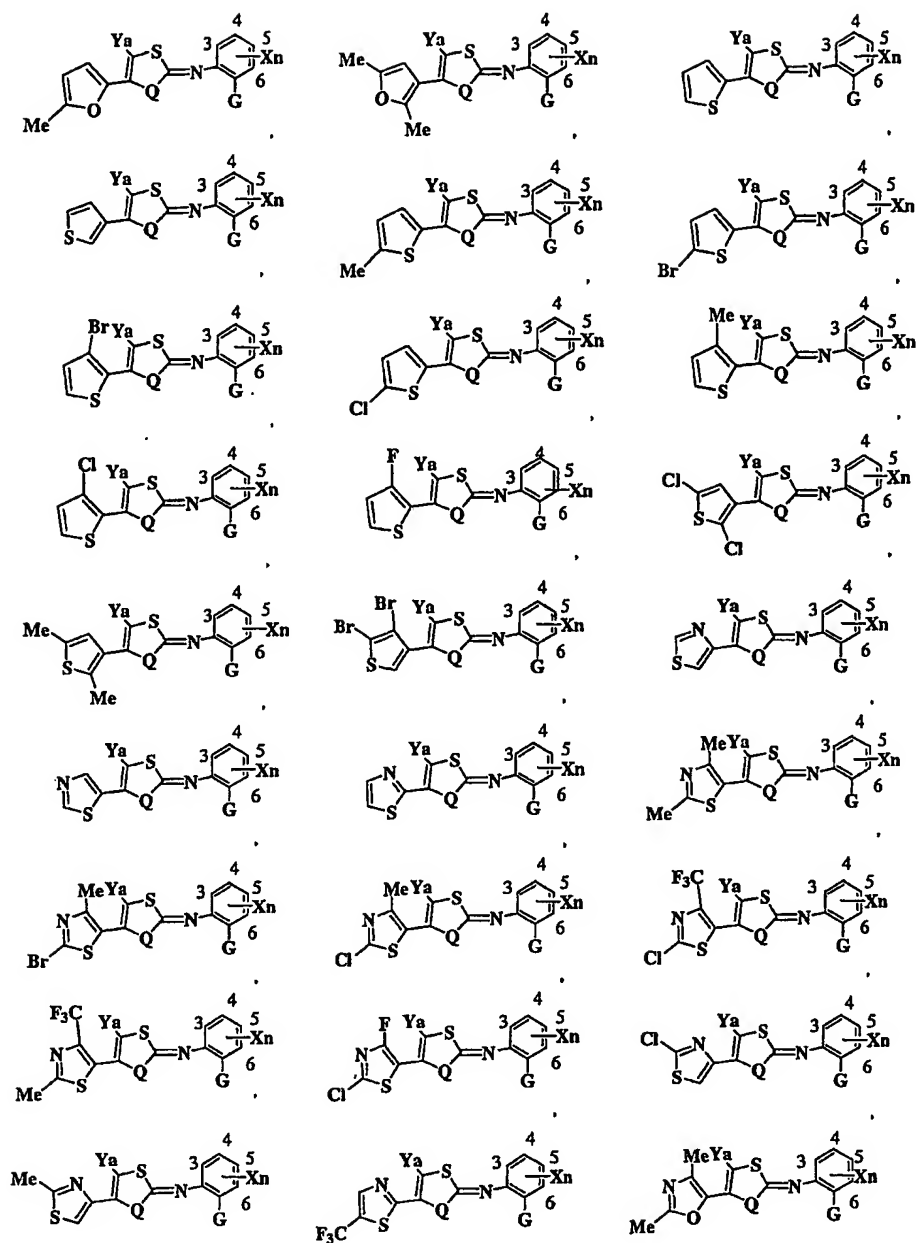
〔第3表〕

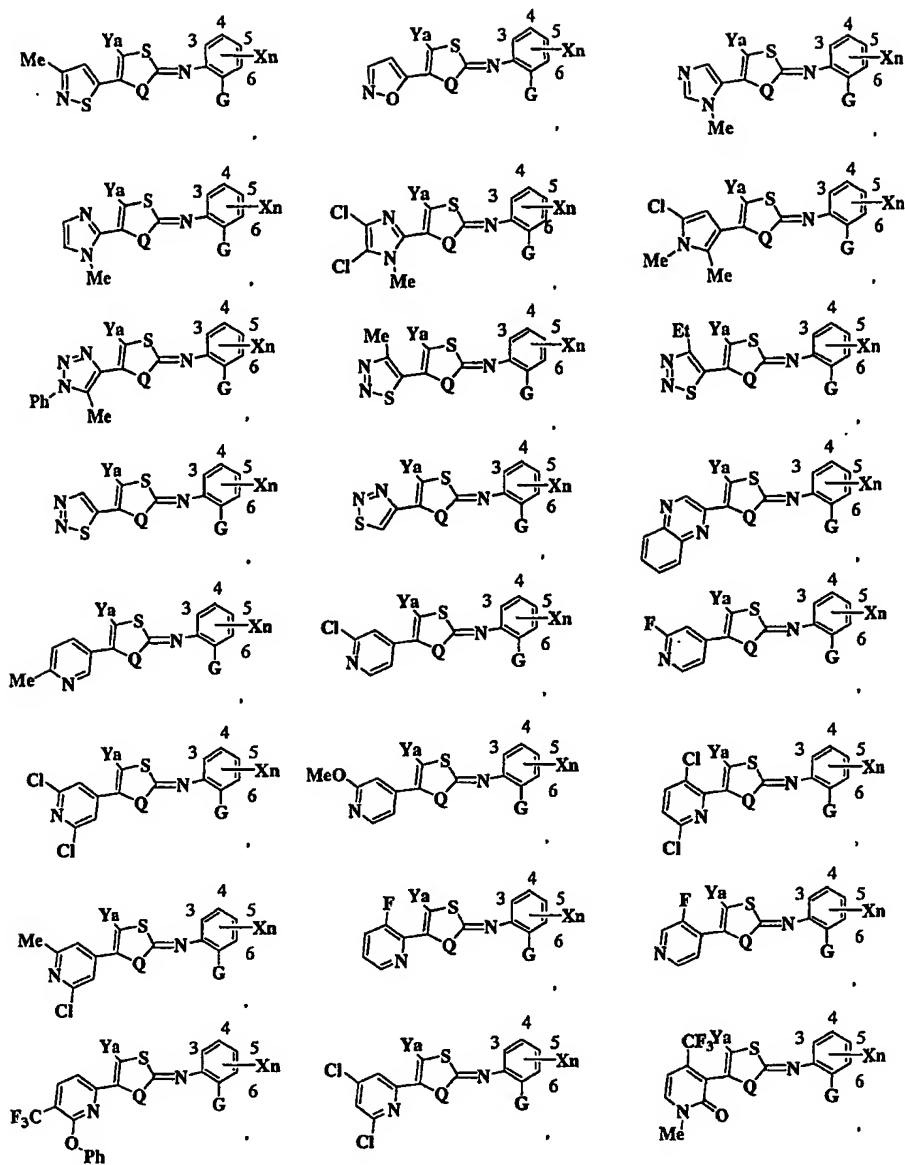


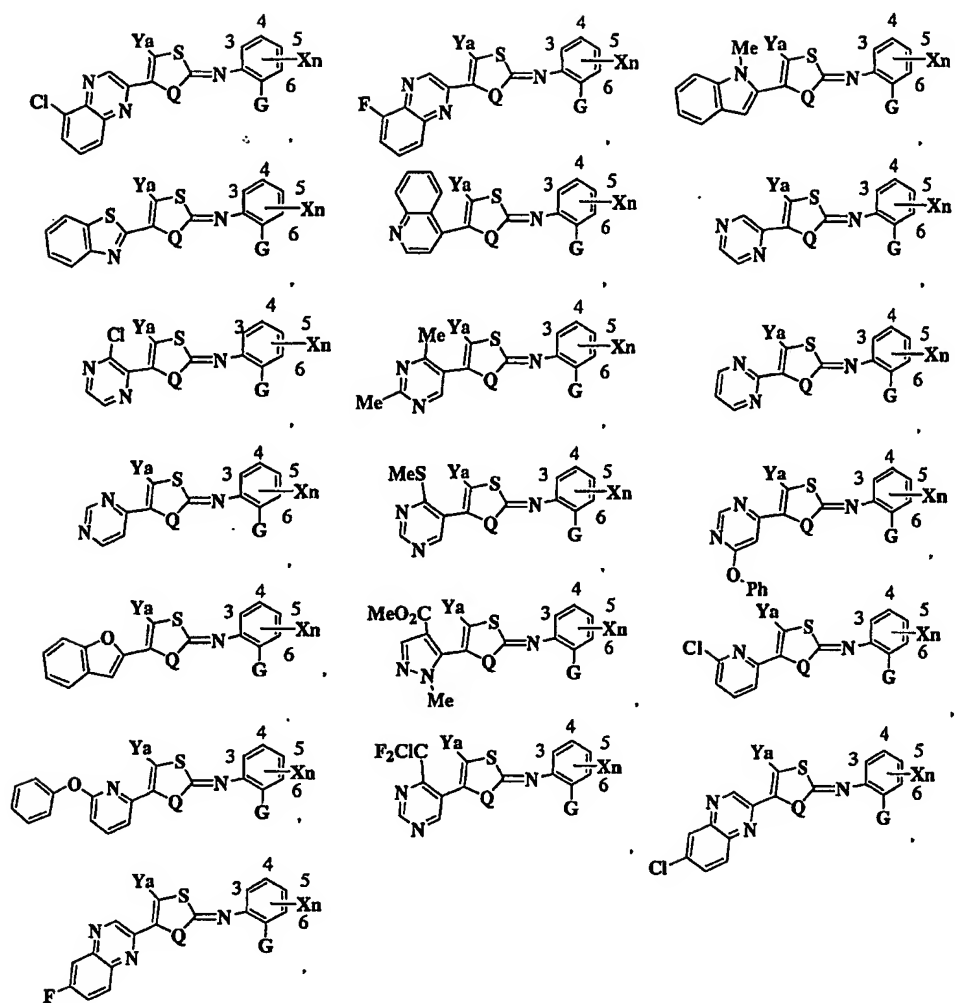


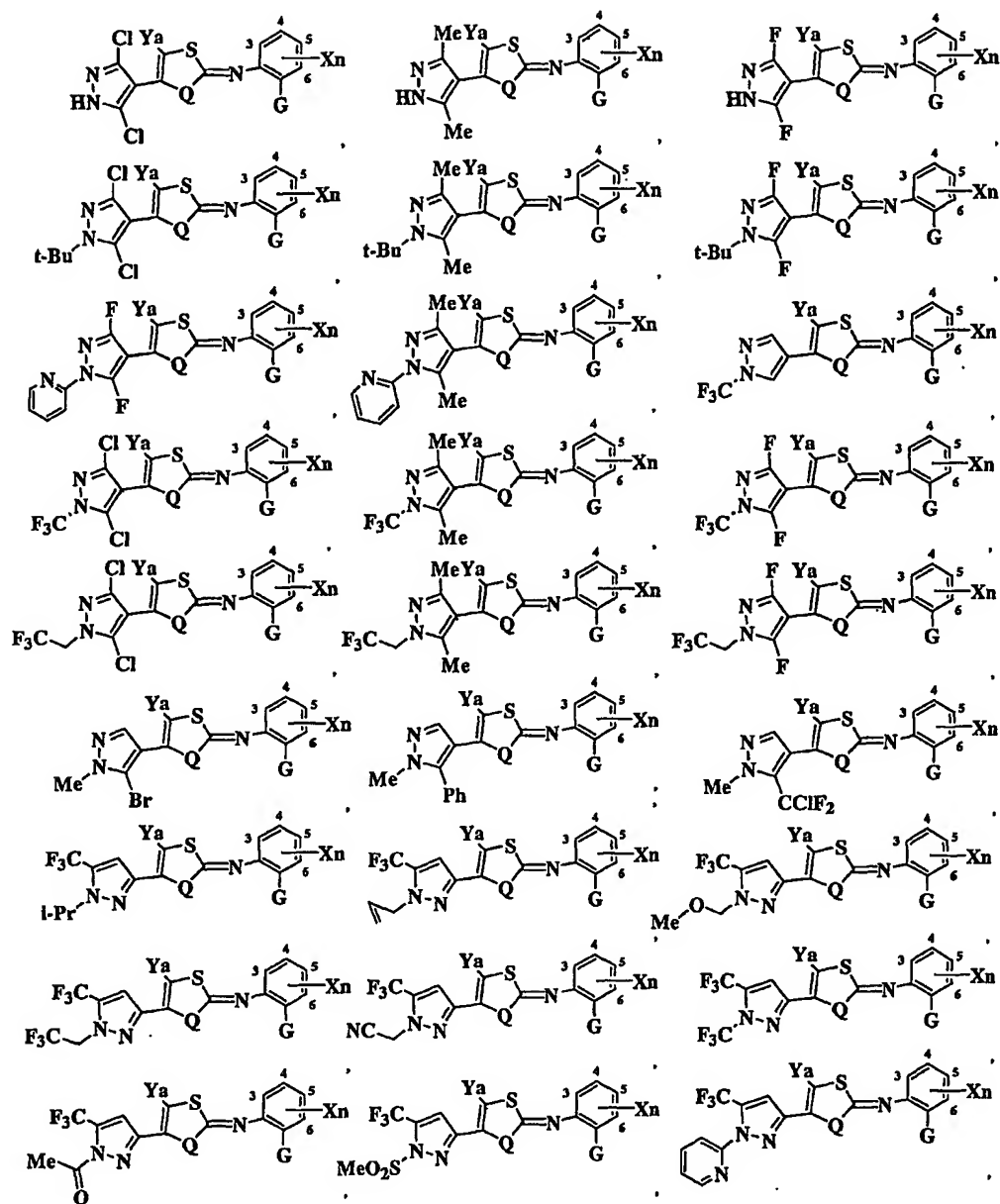


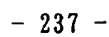


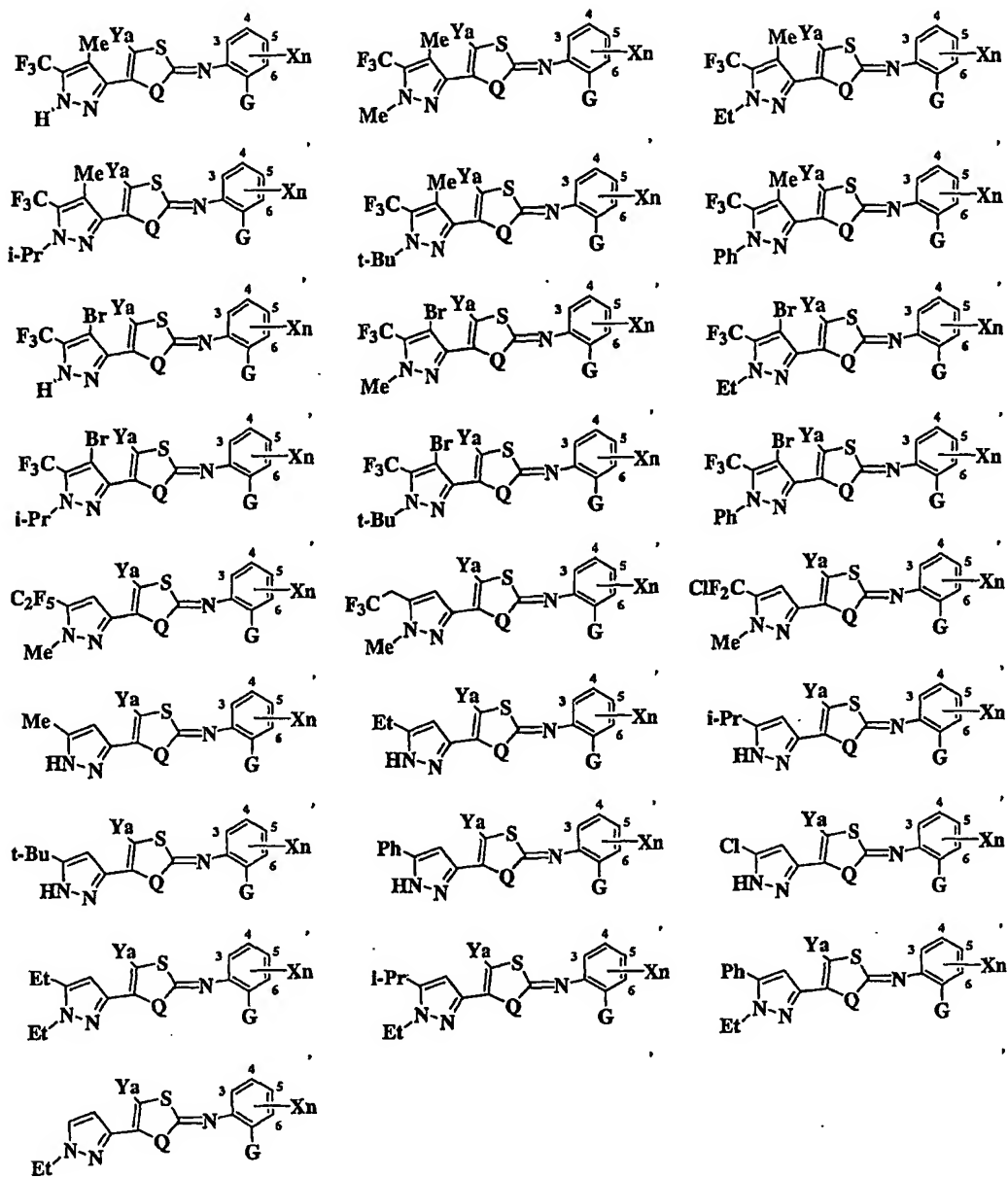


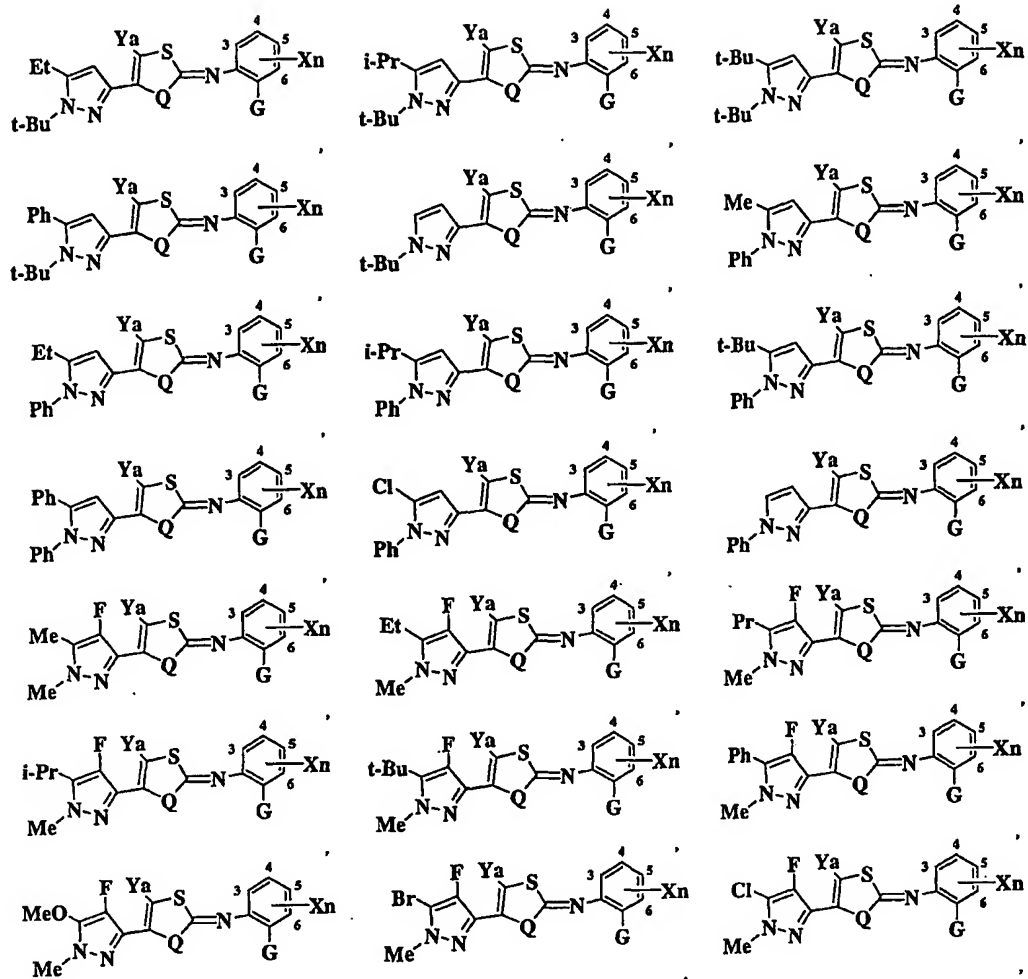


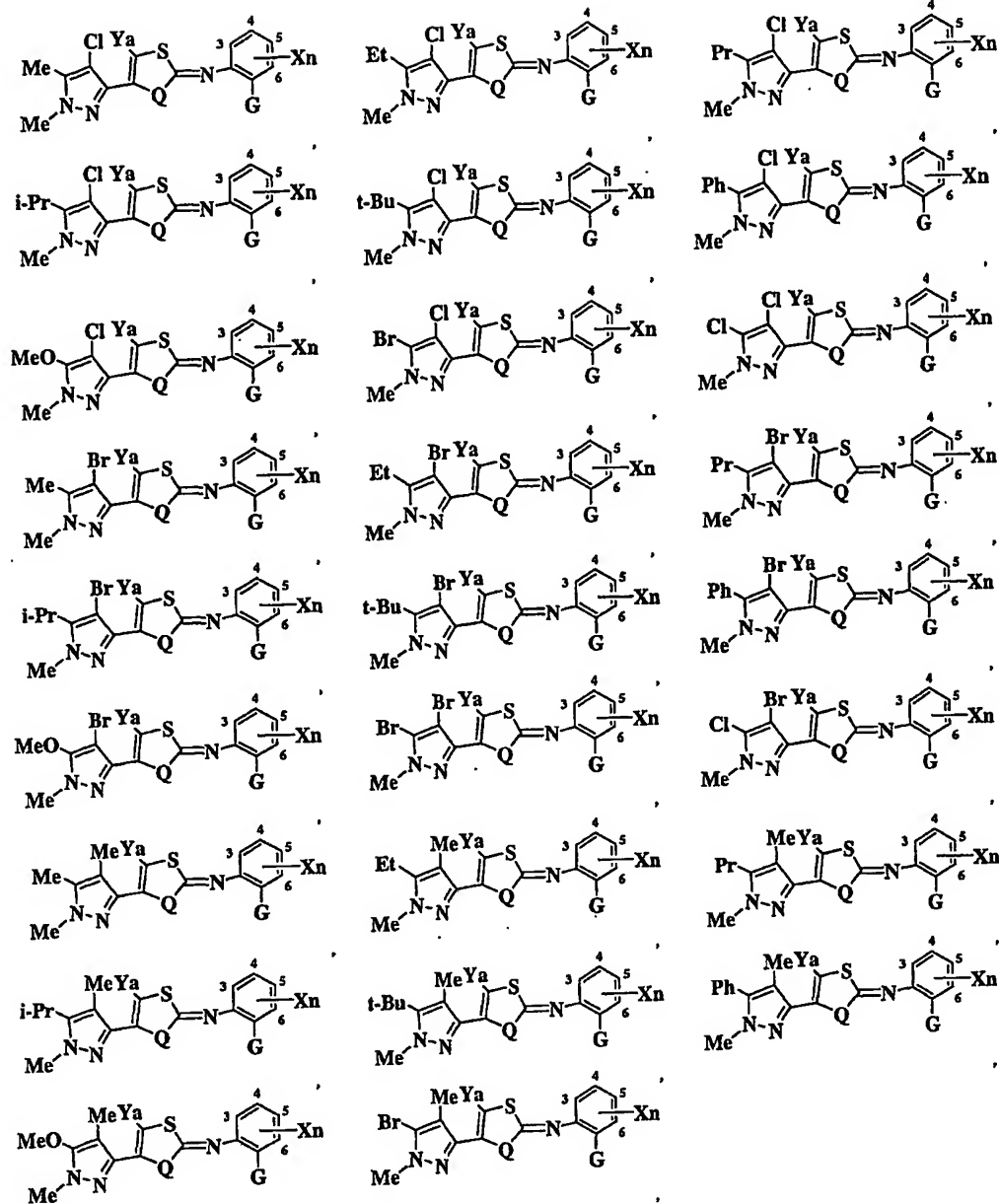


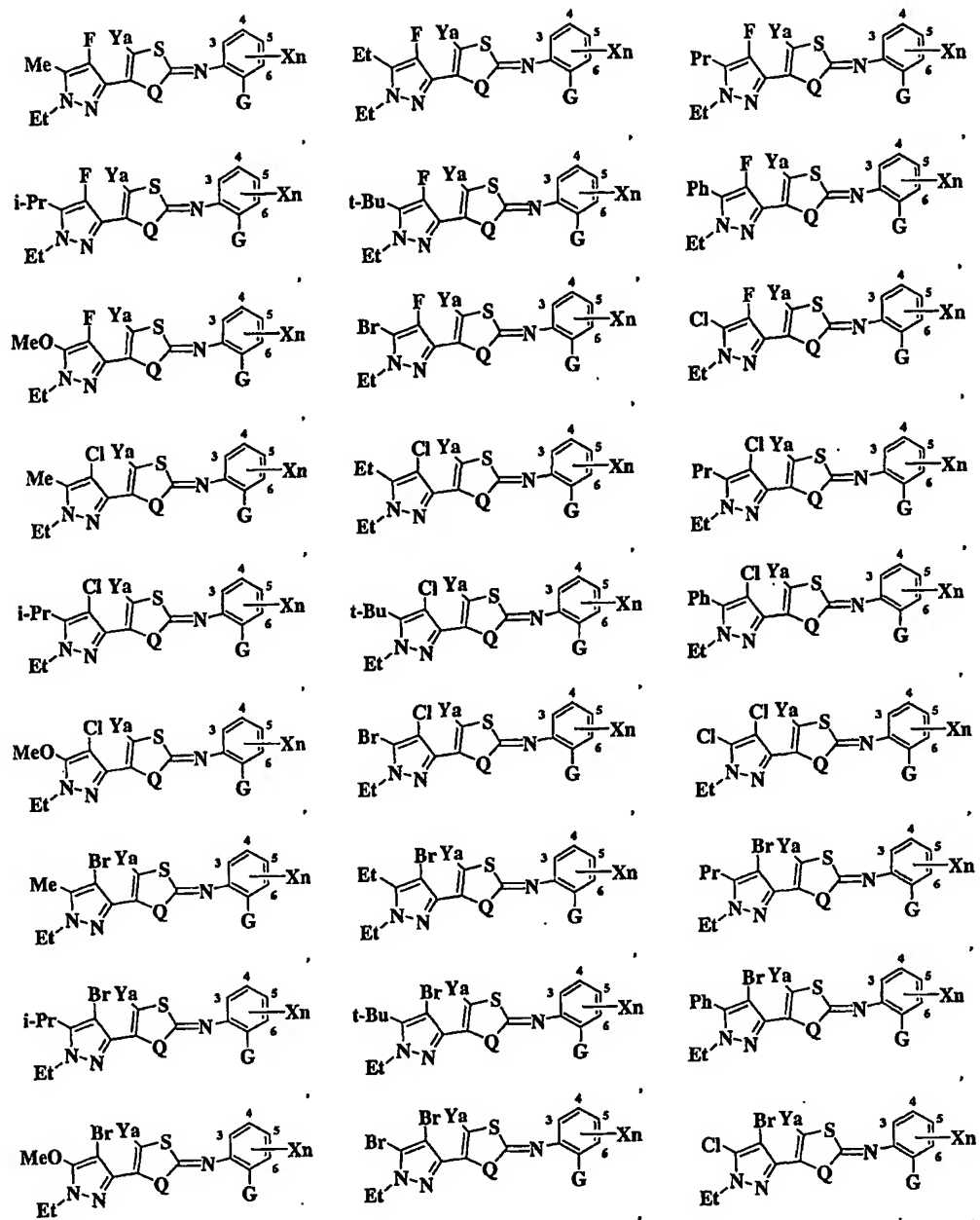


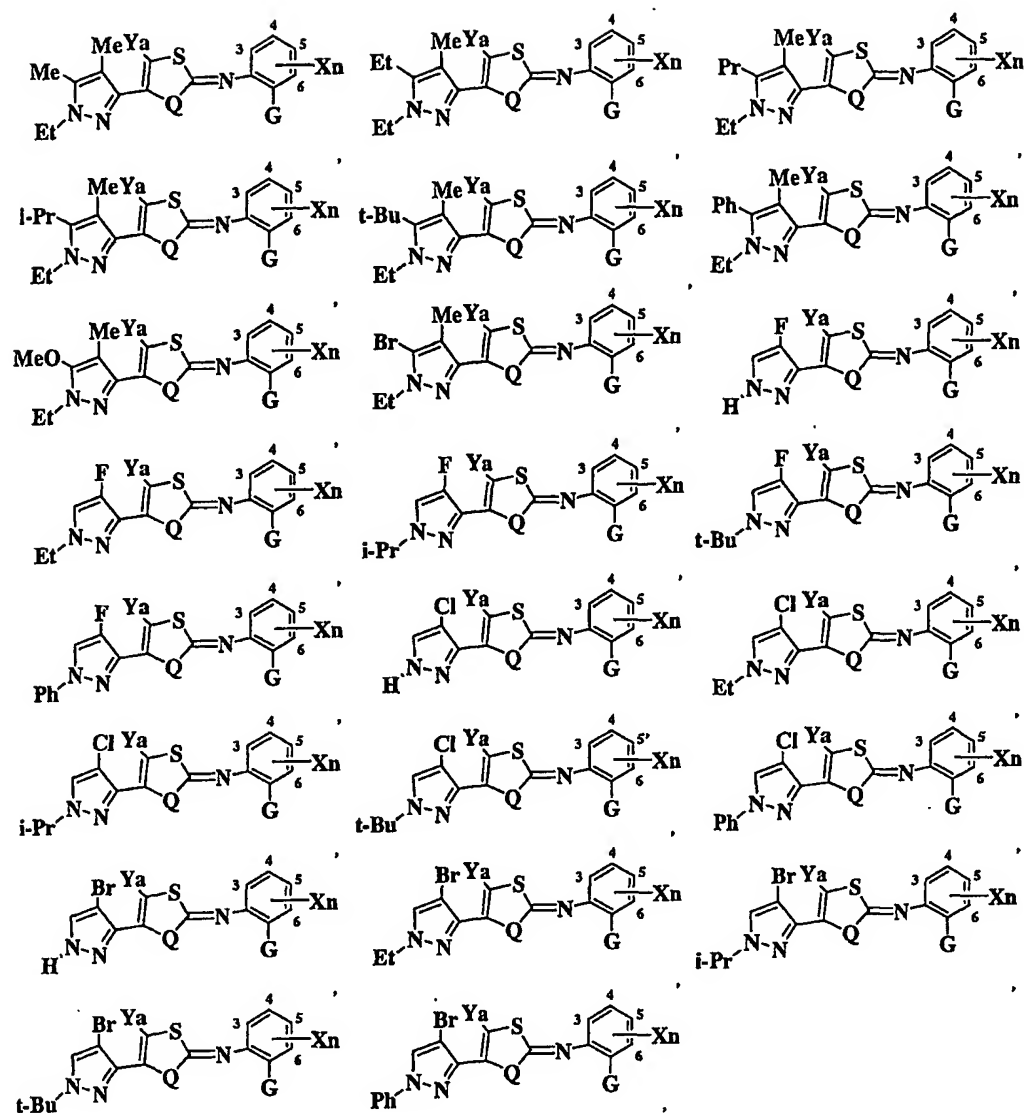


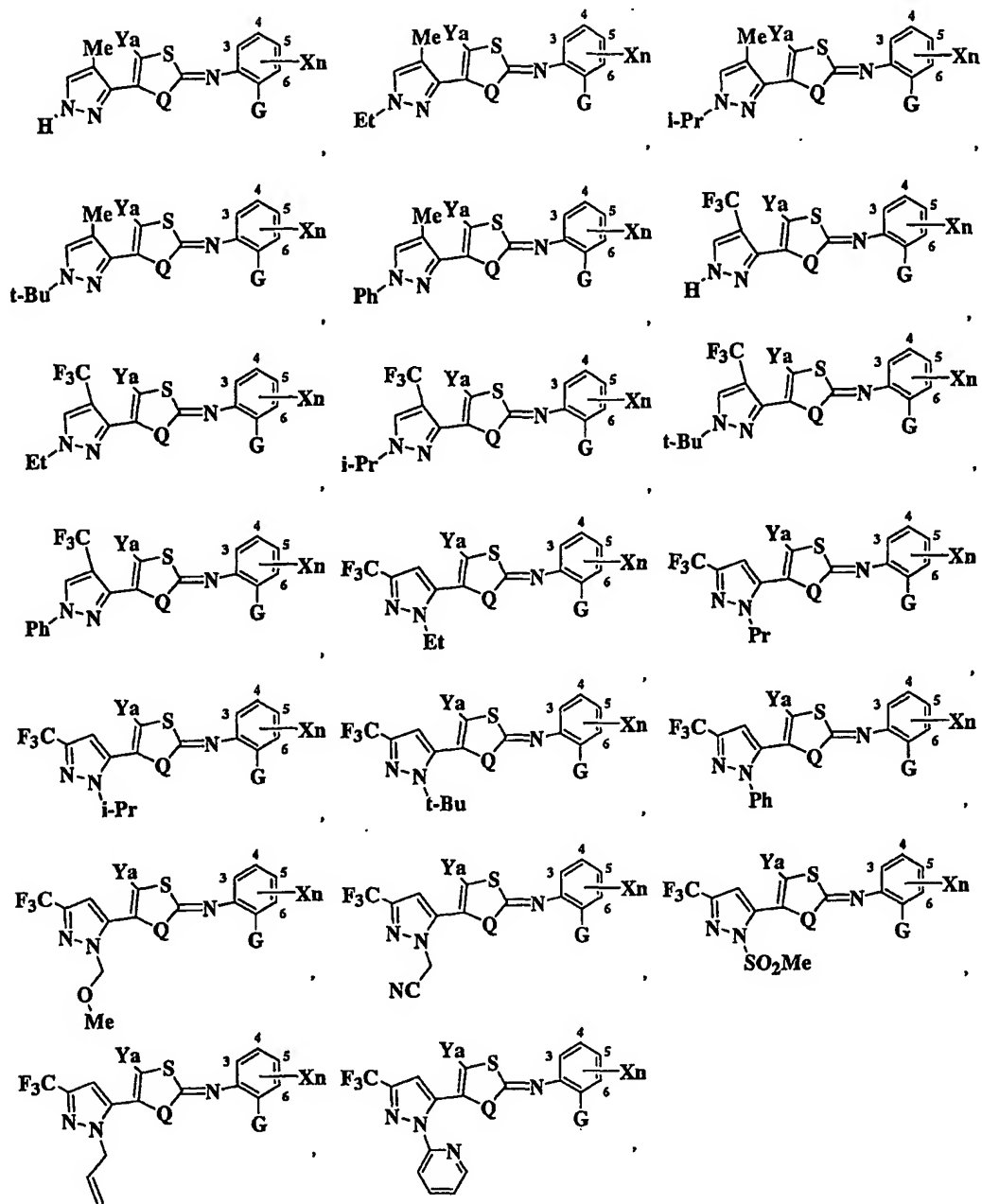


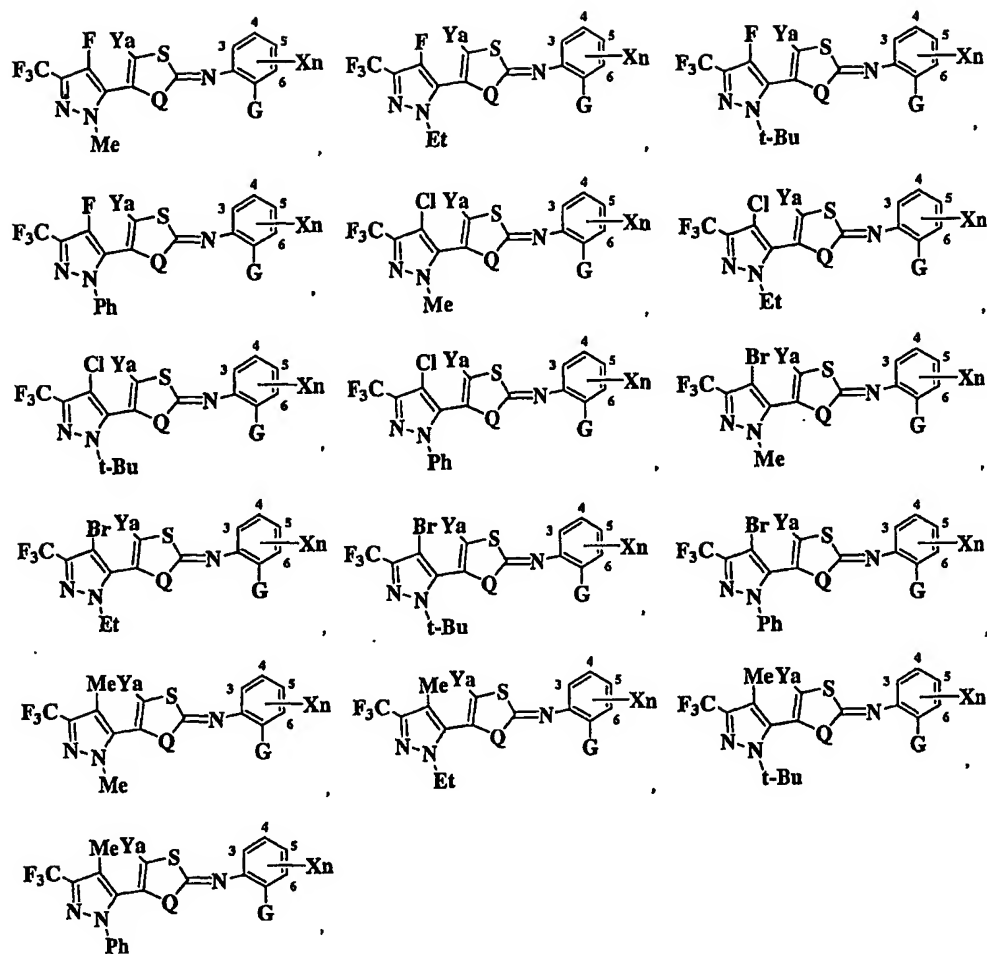


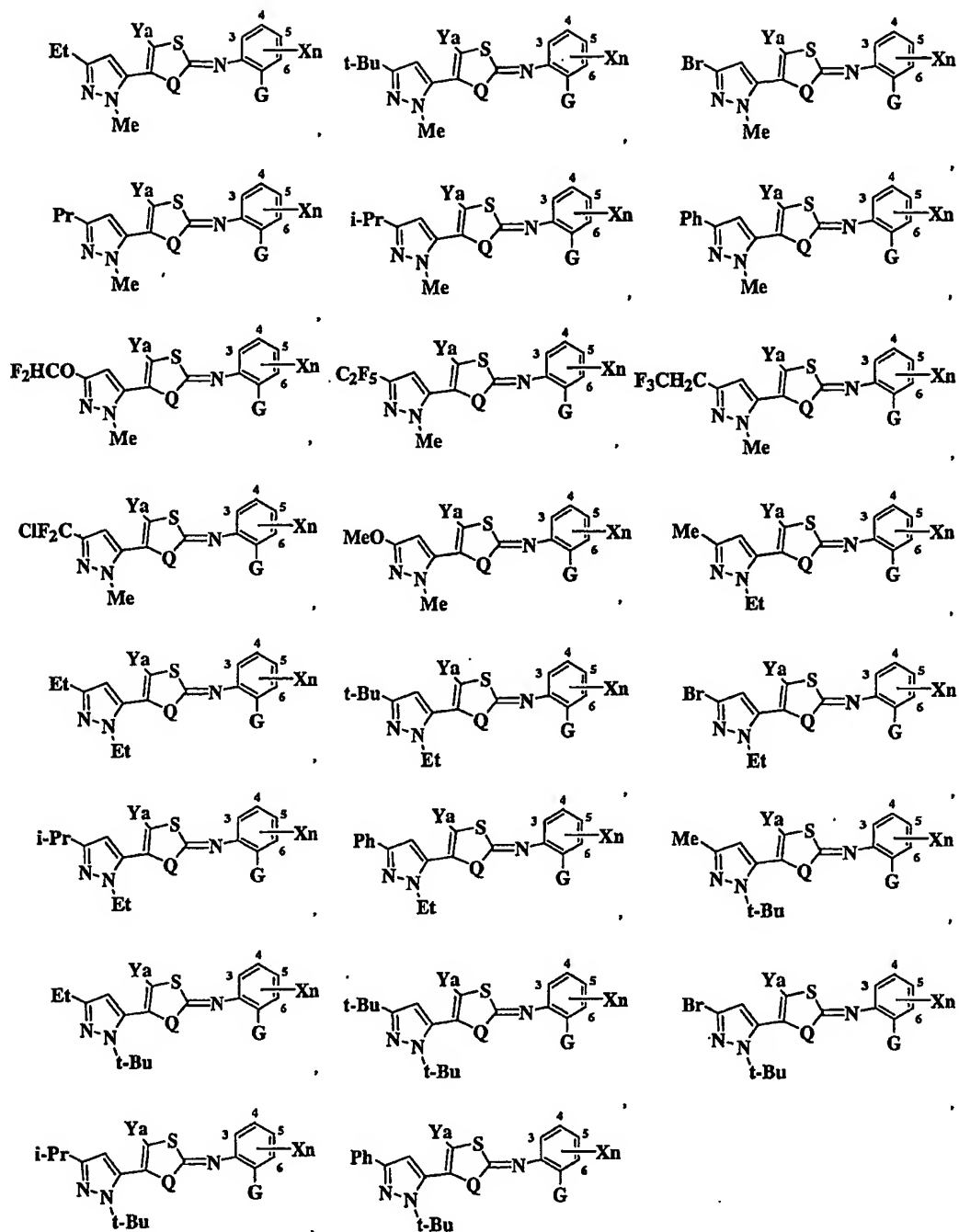


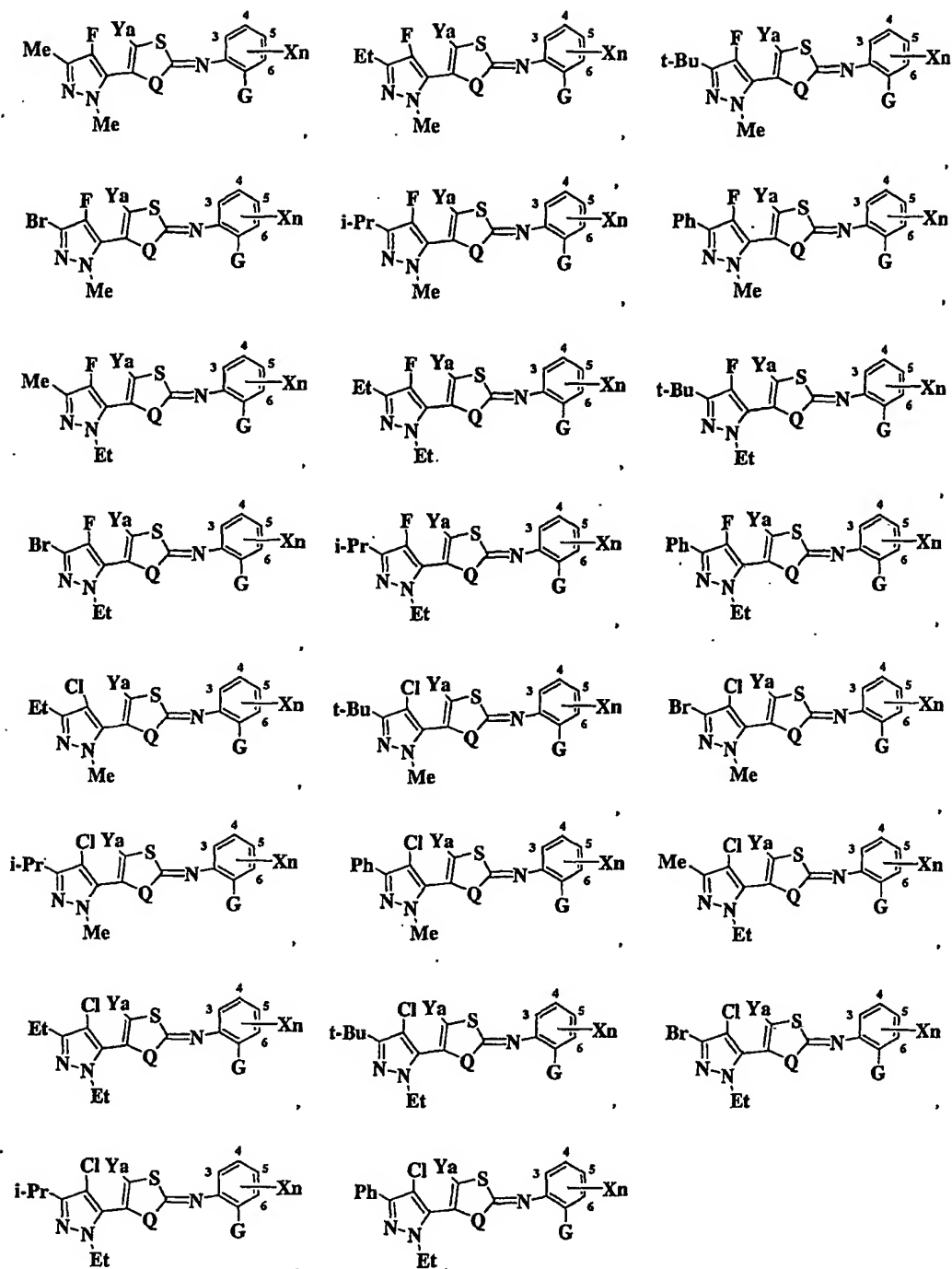


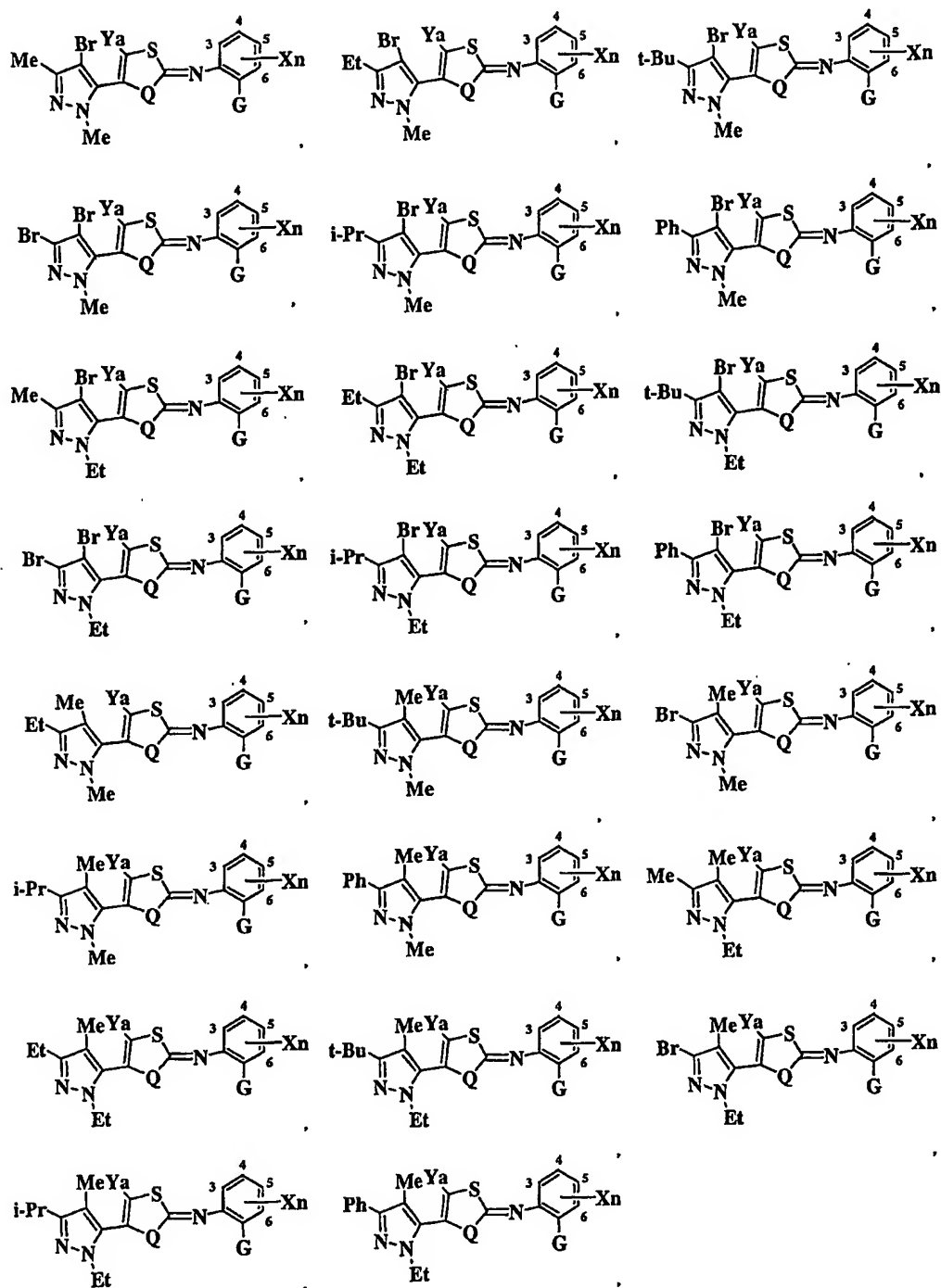


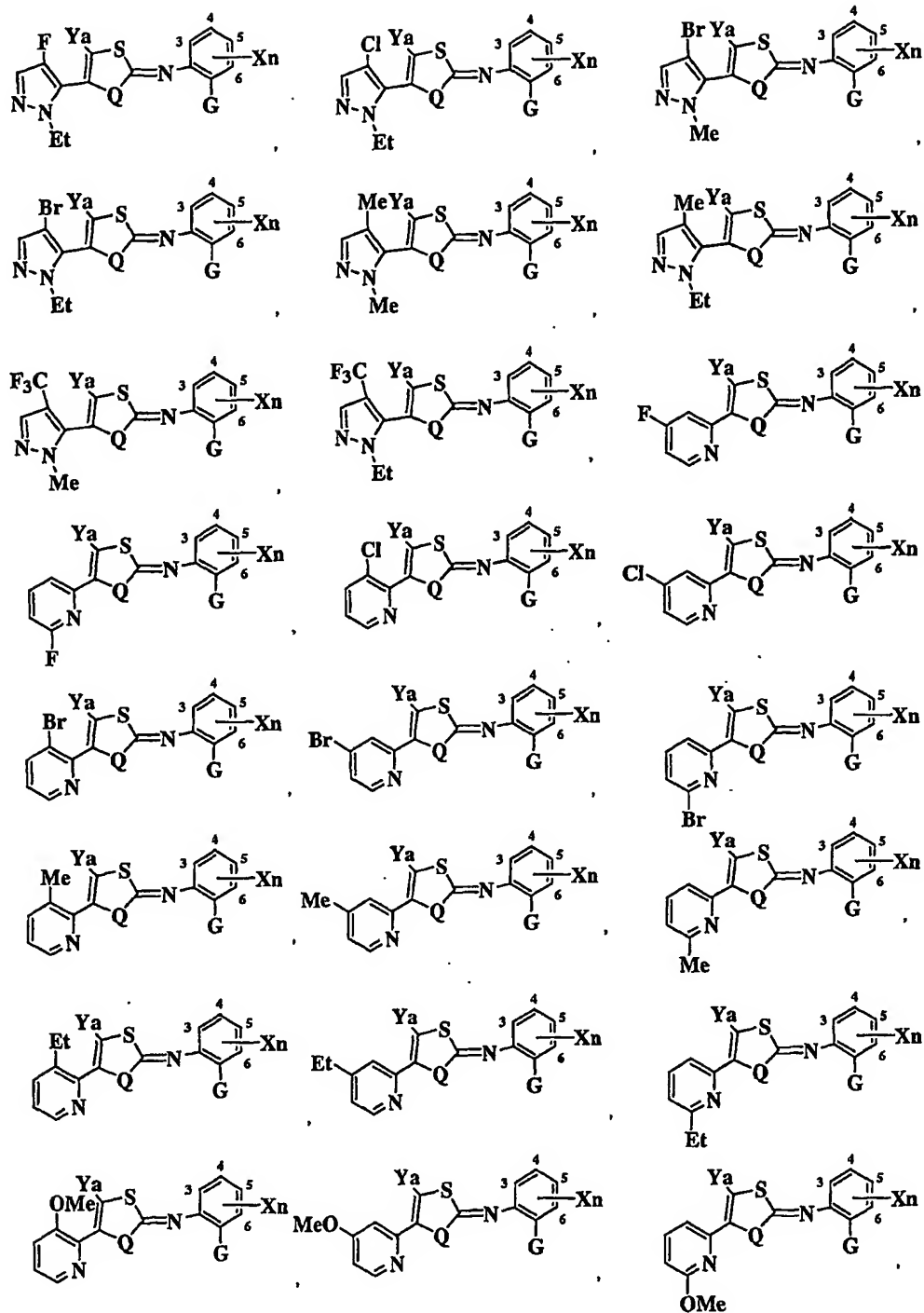


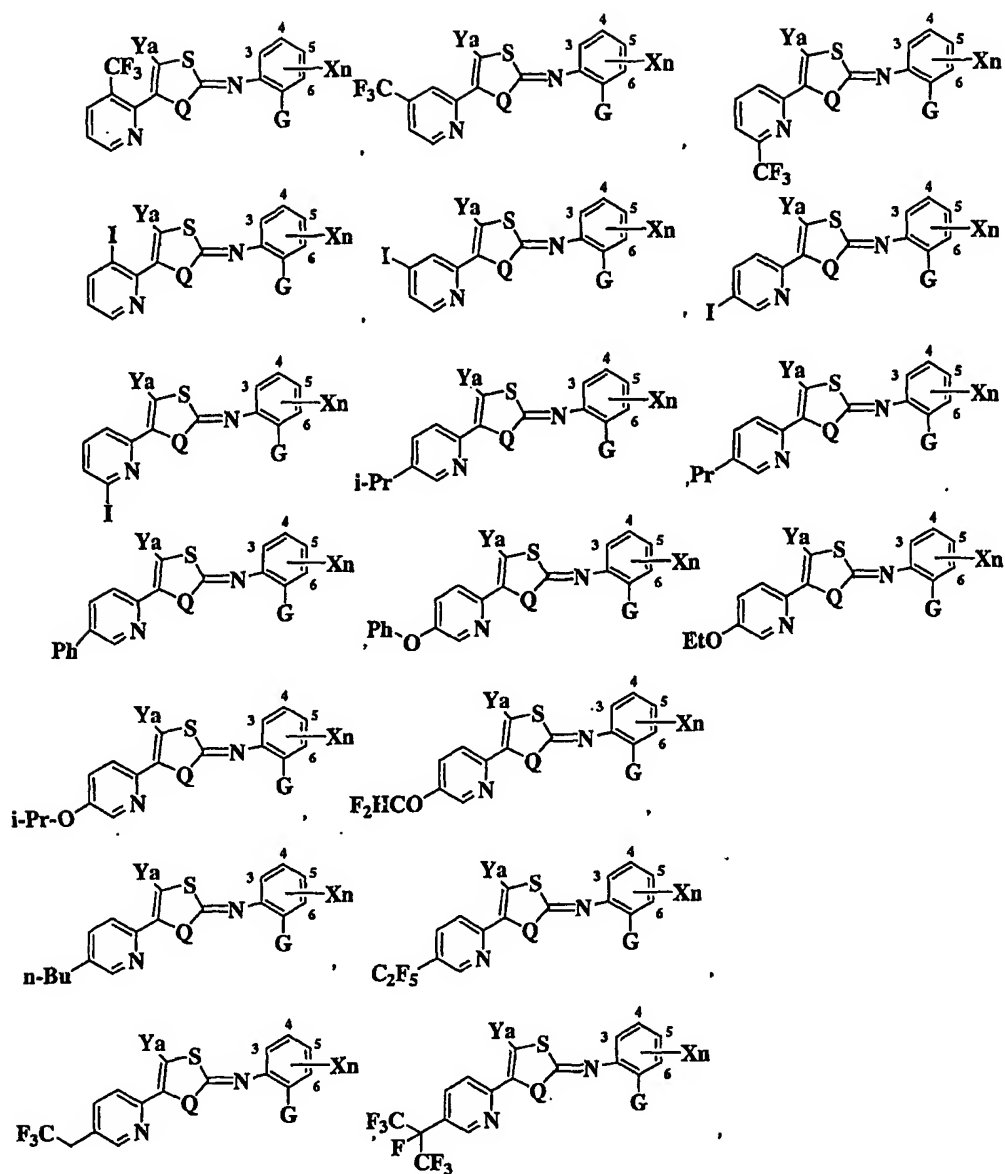


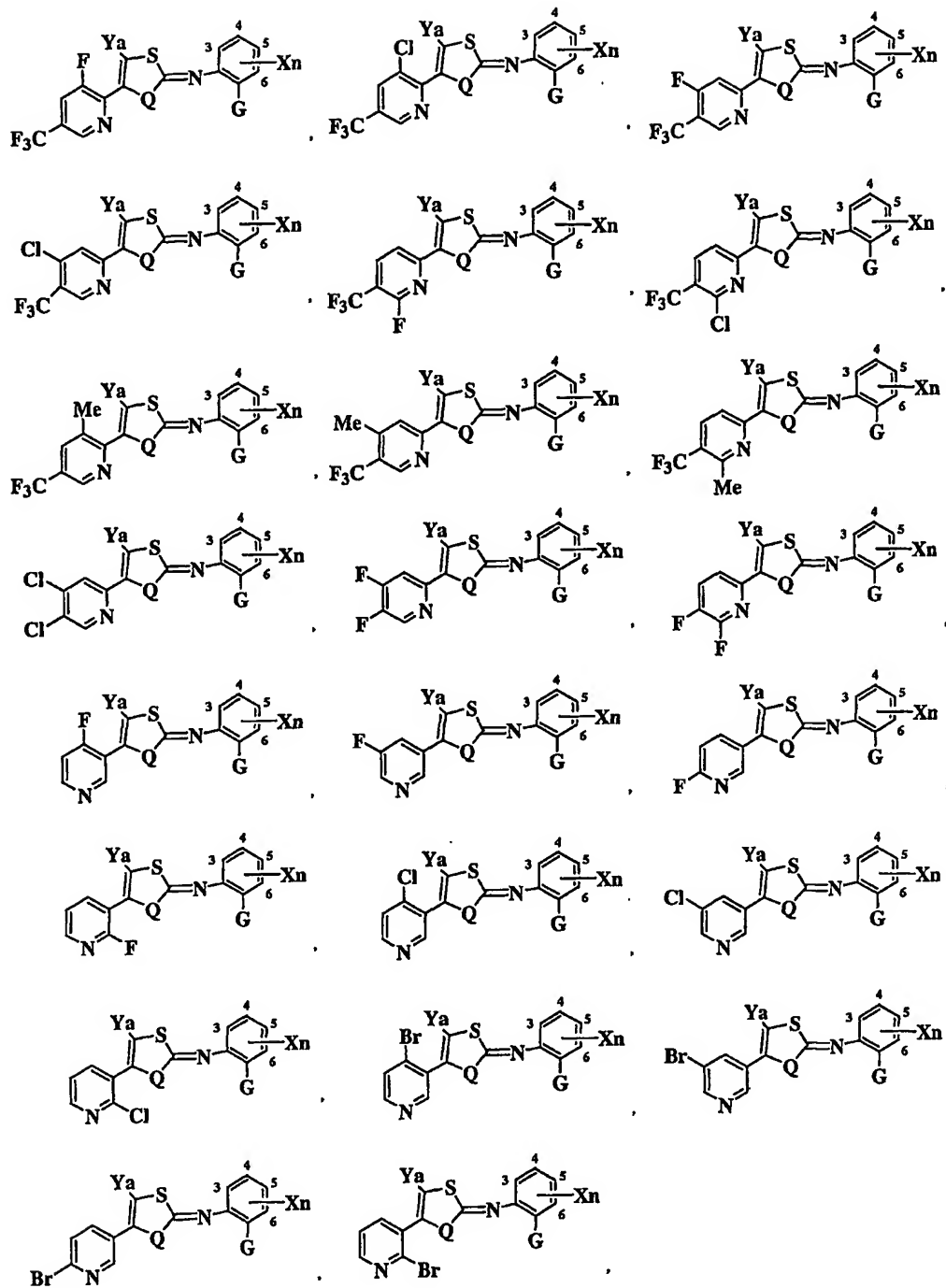


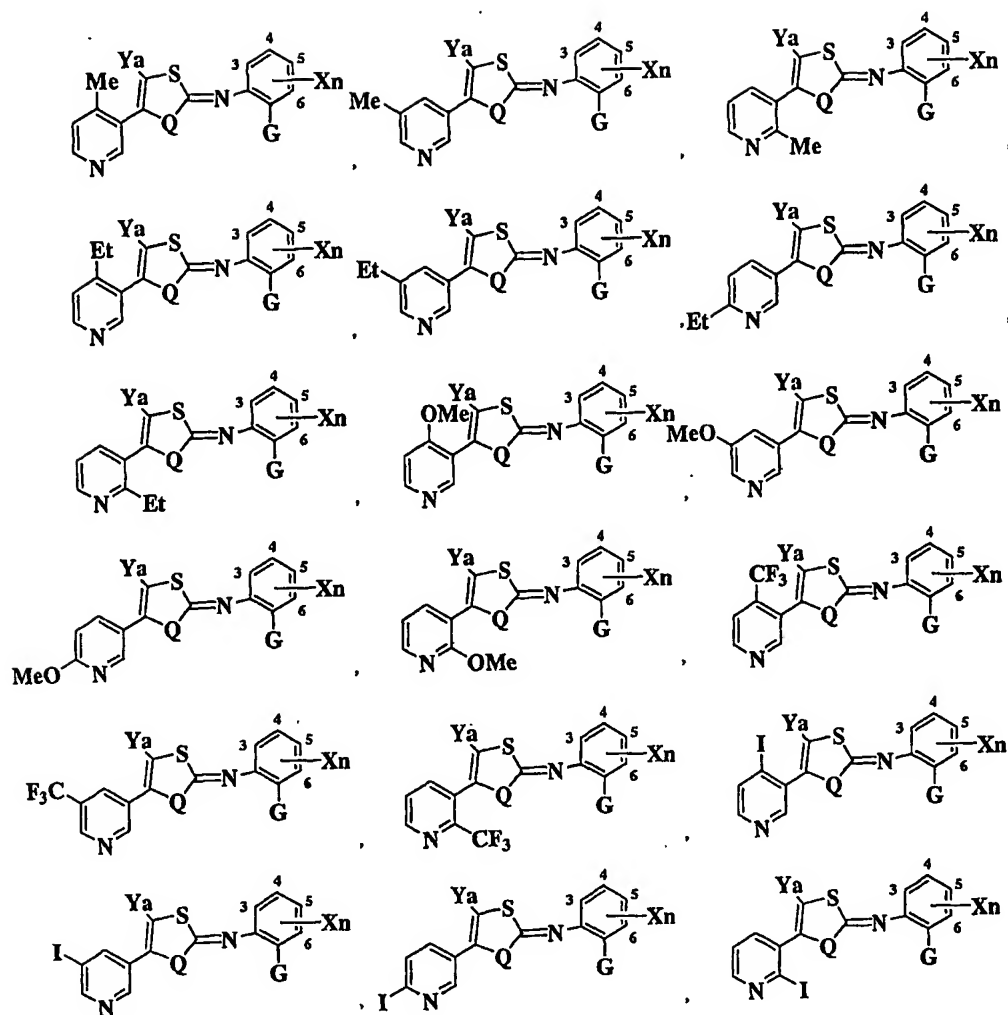


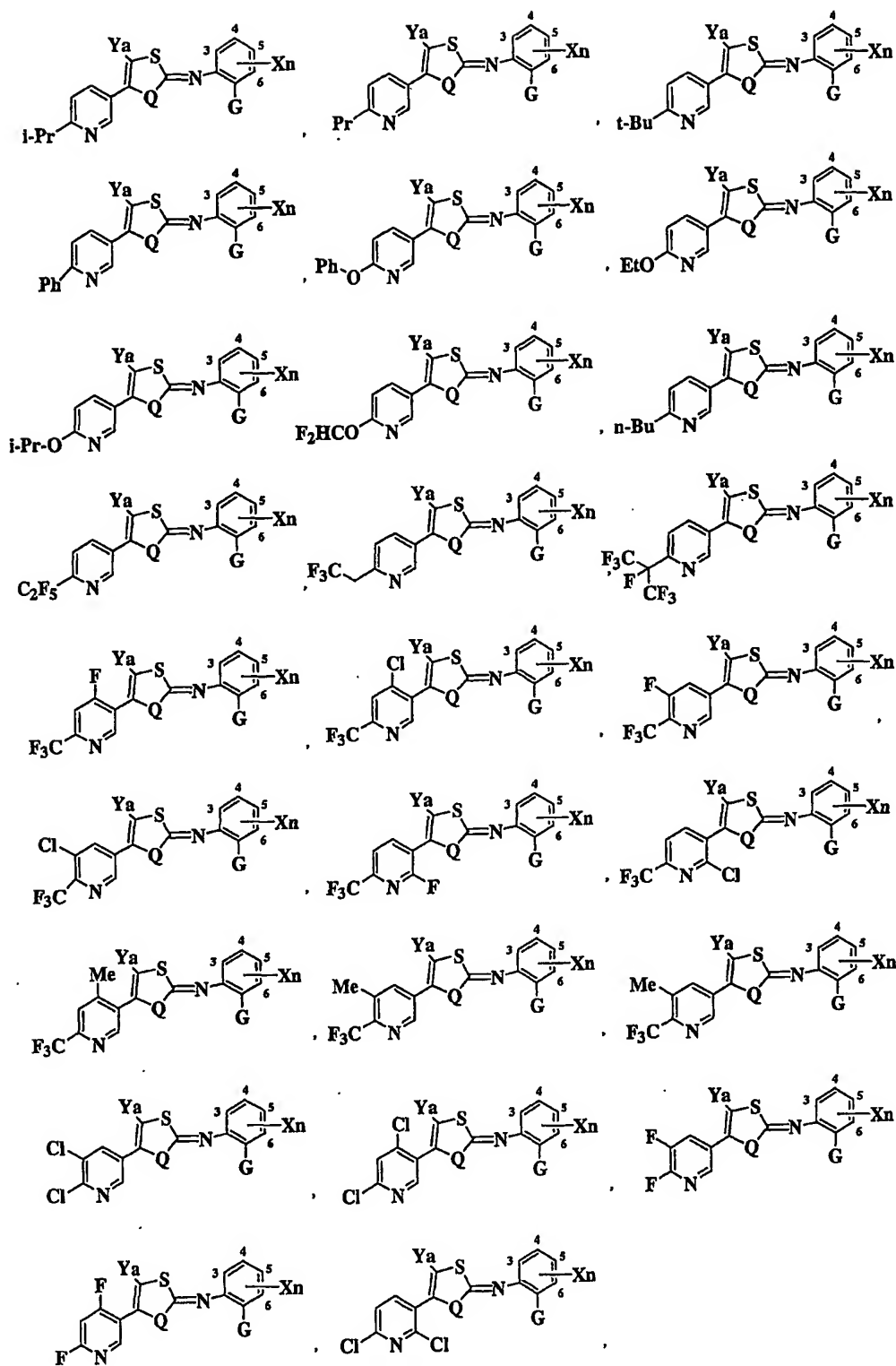


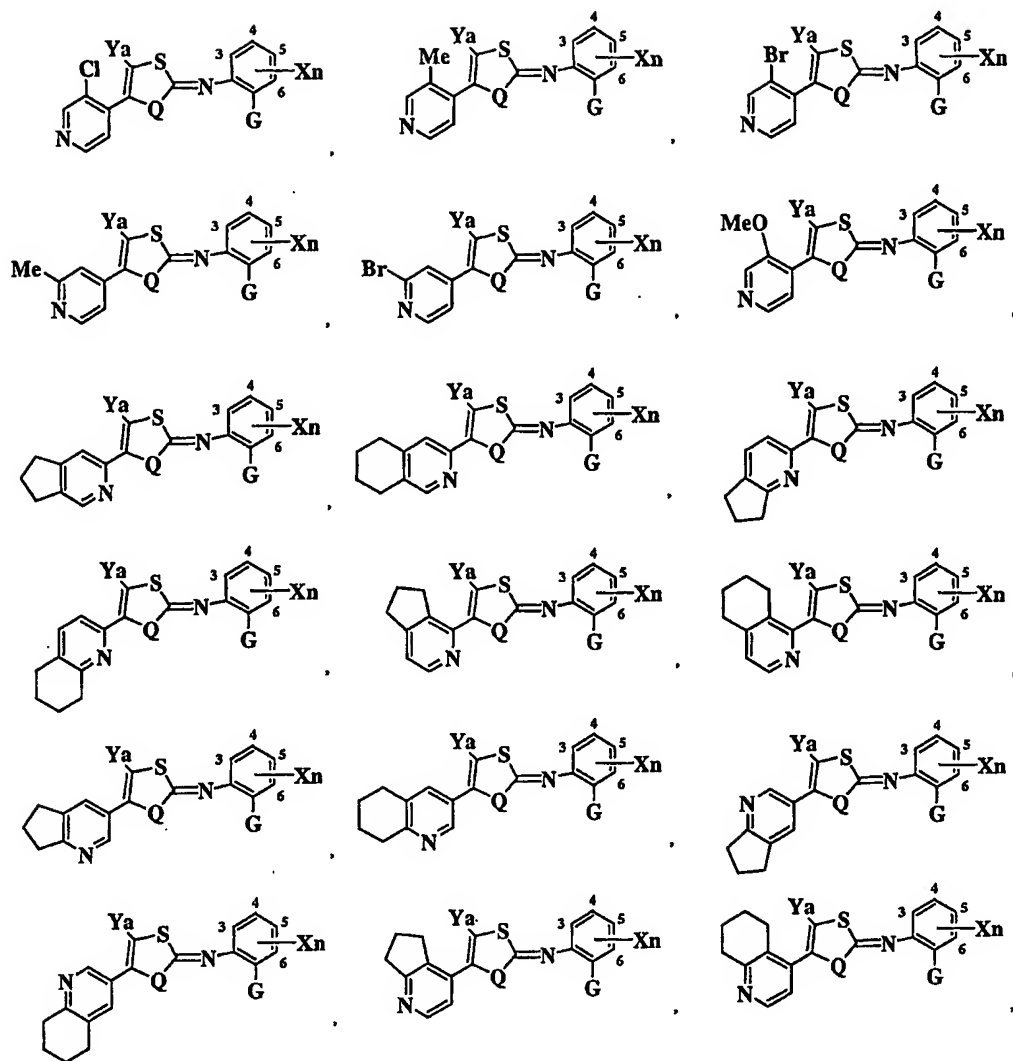


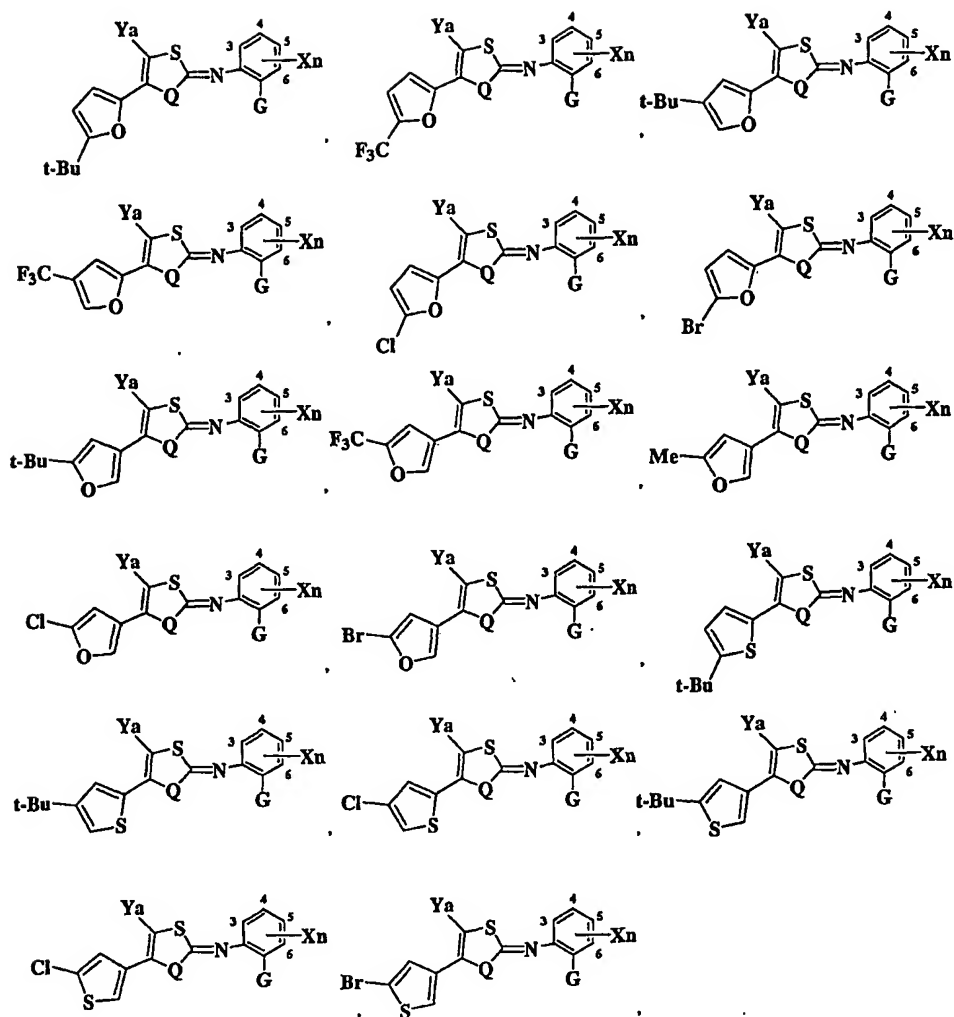


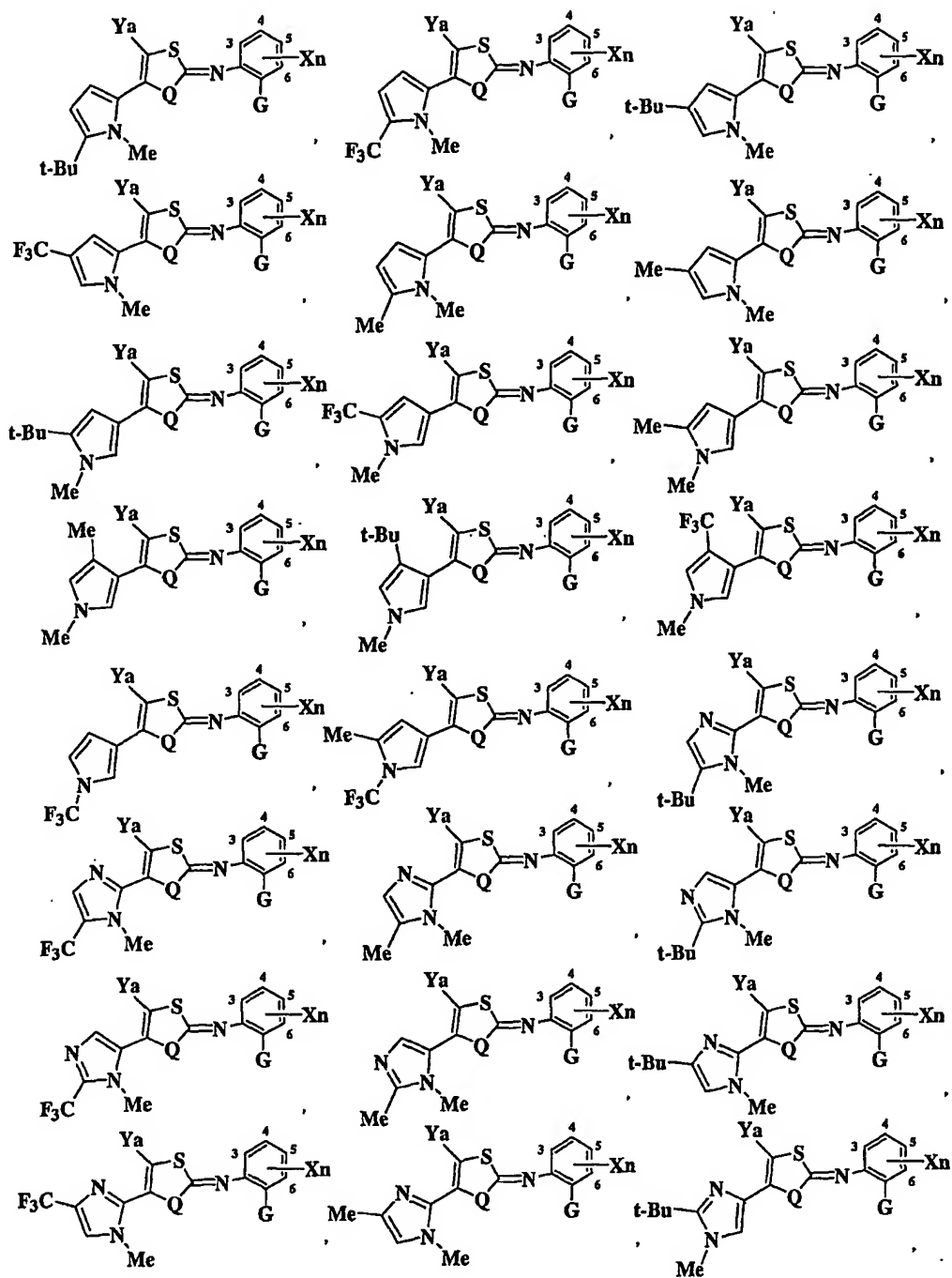


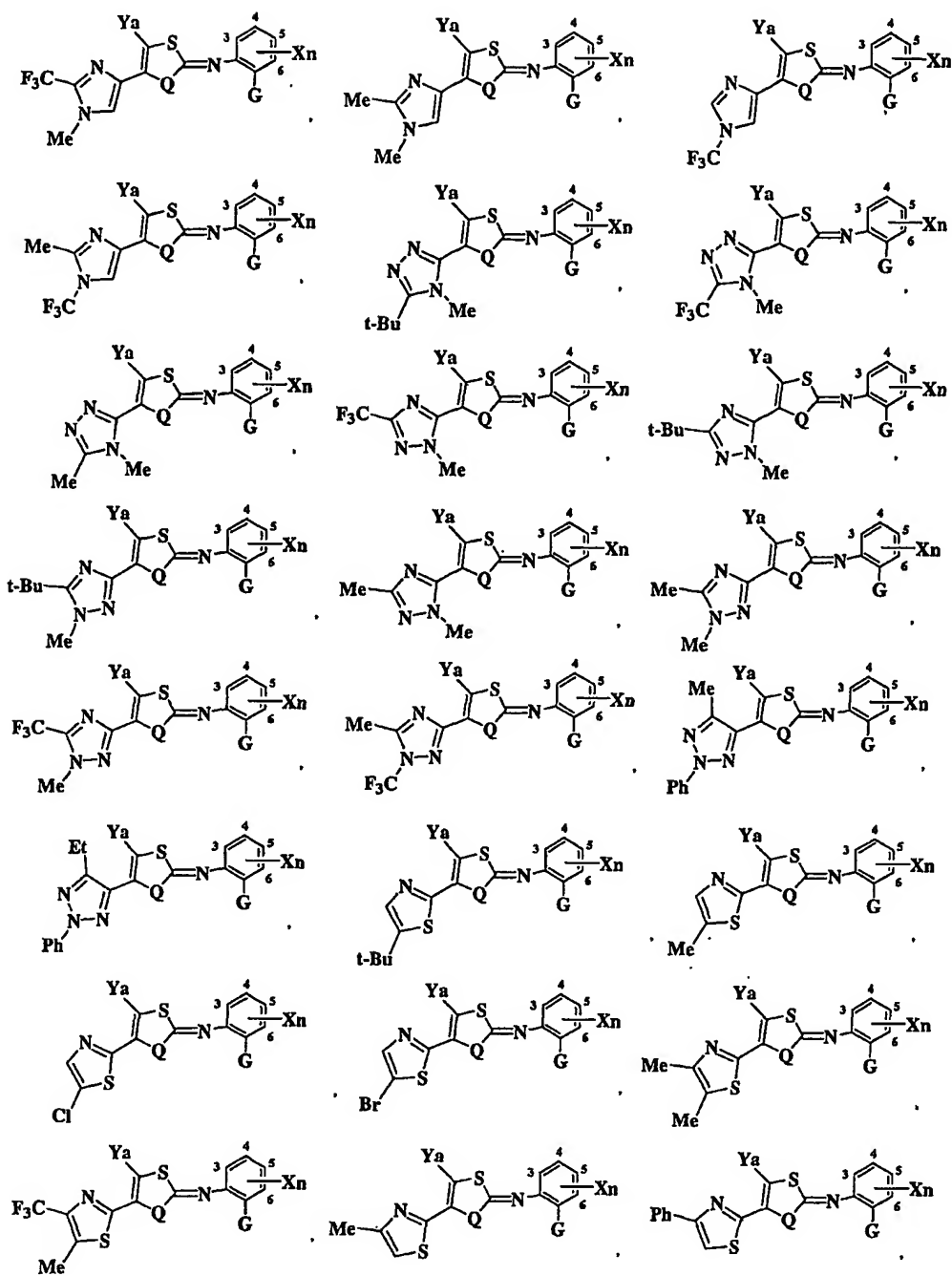


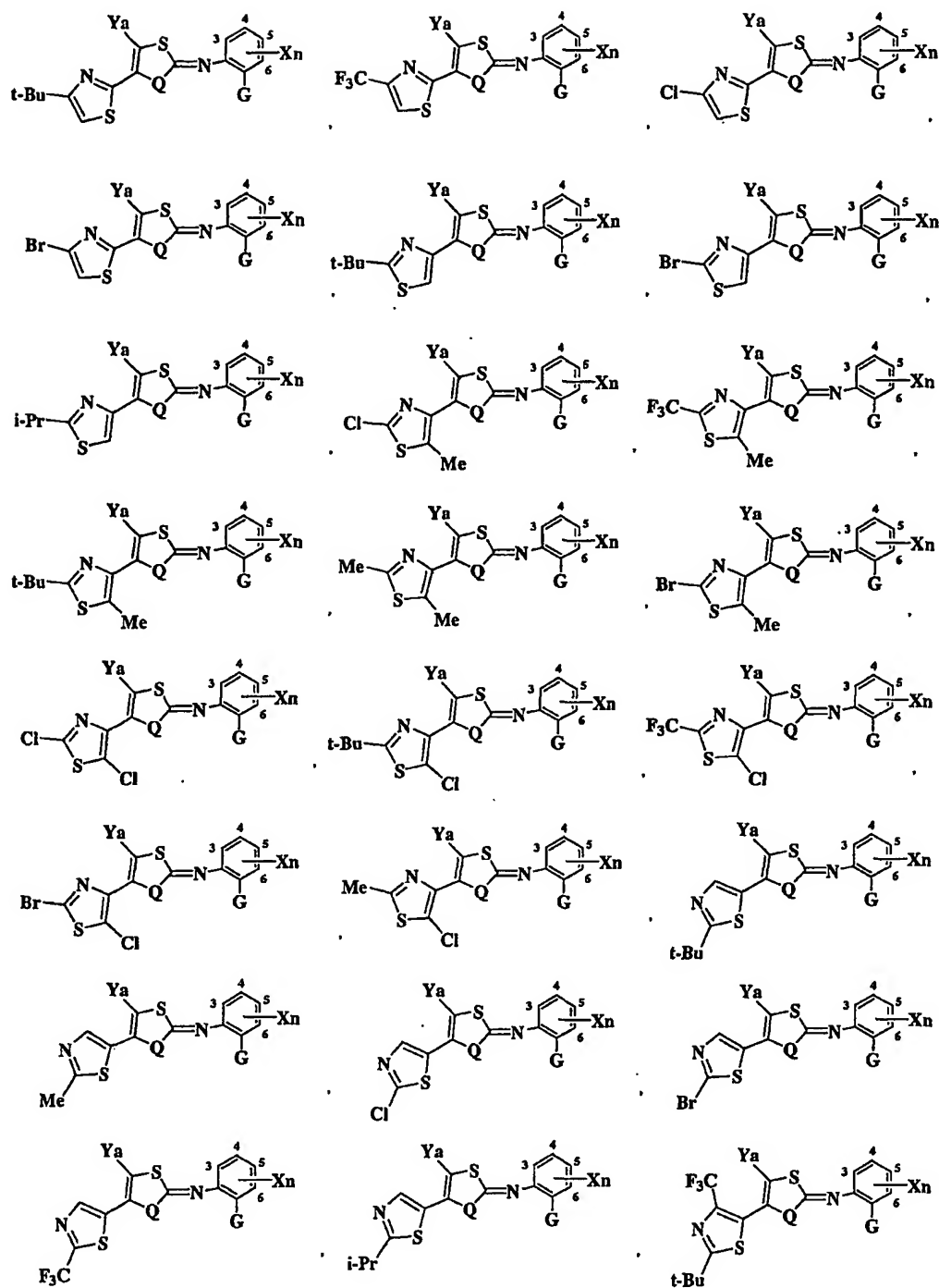


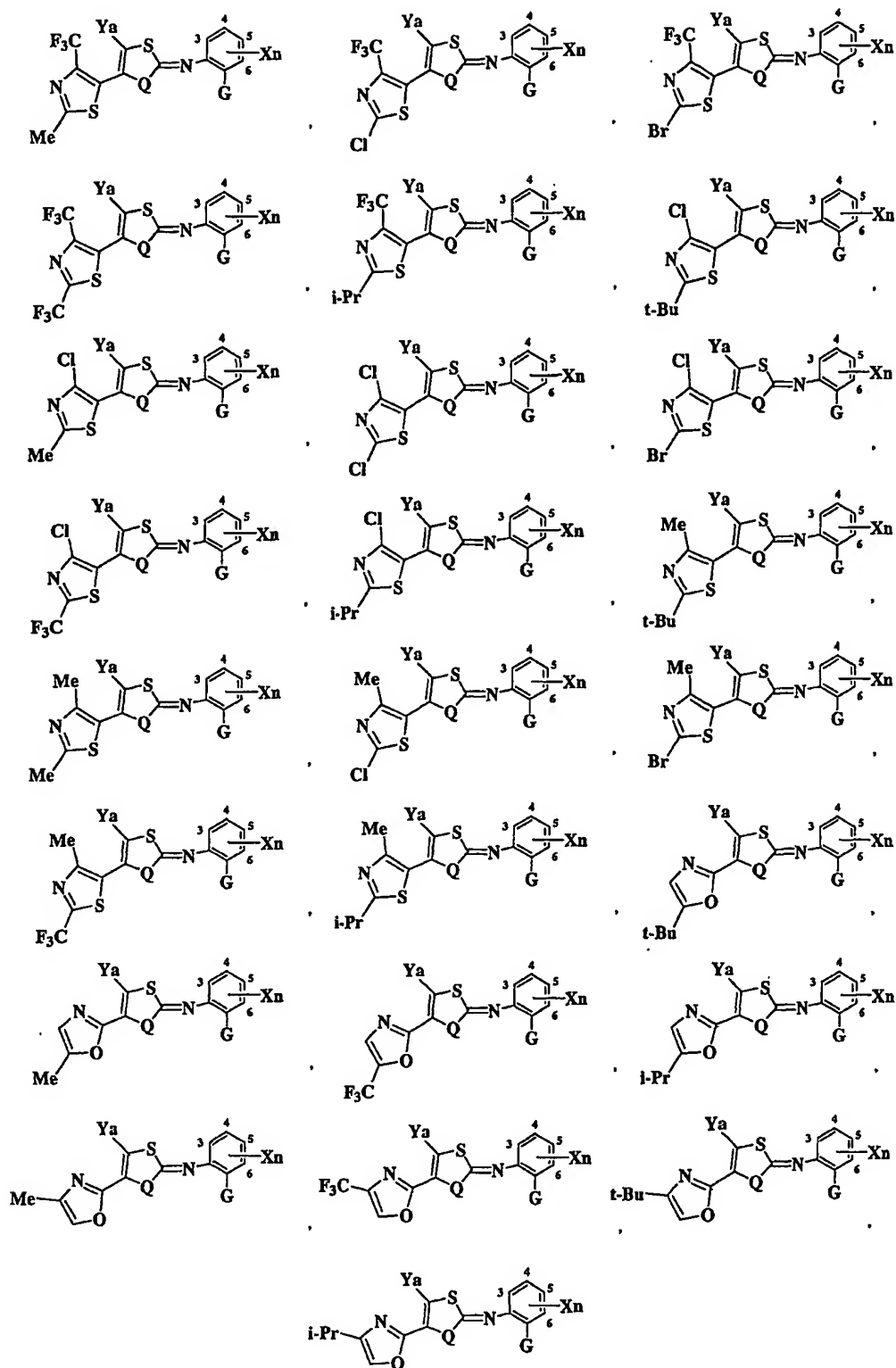


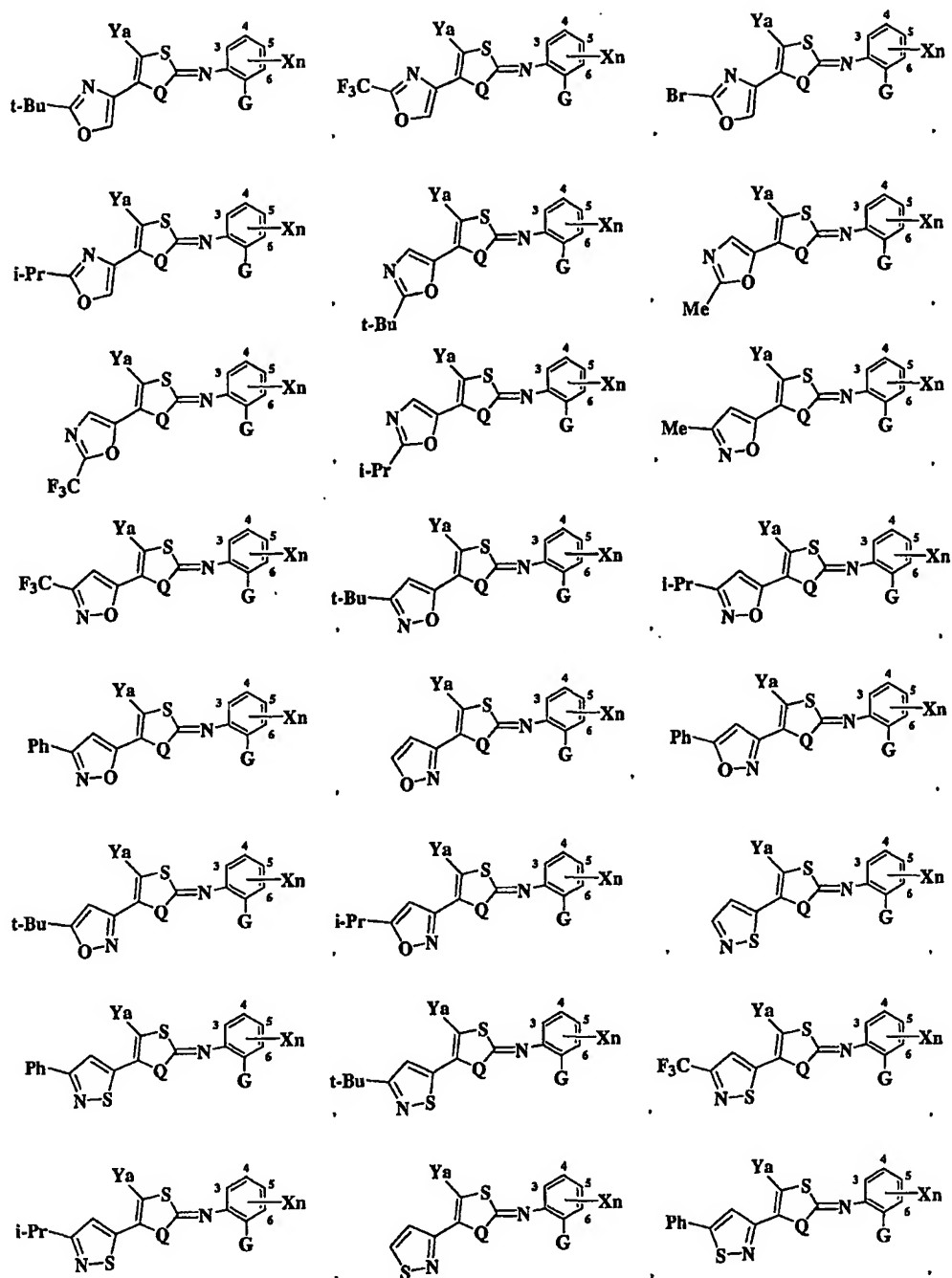


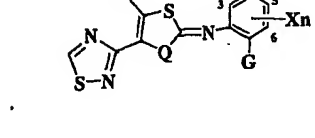
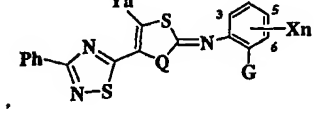
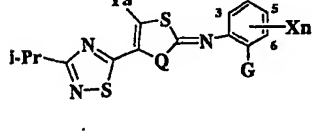
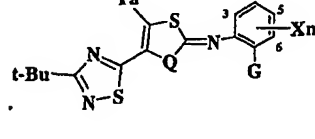
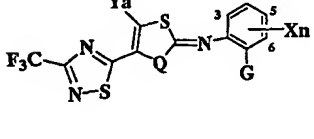
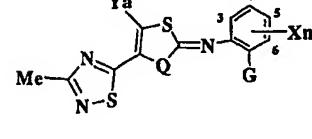
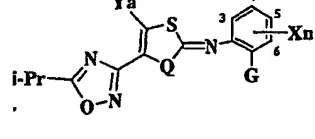
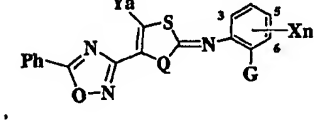
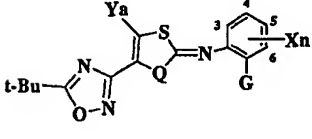
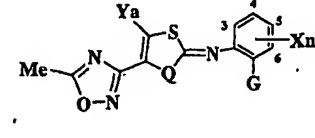
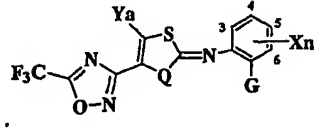
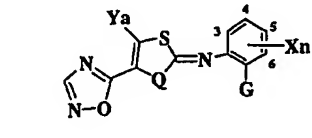
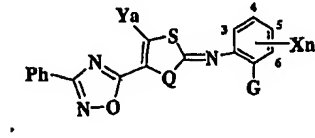
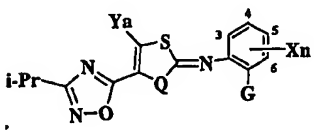
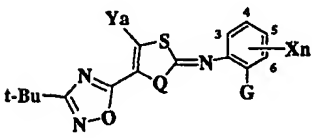
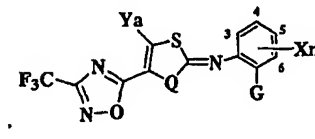
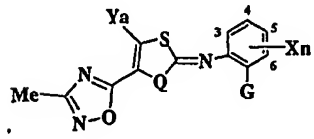
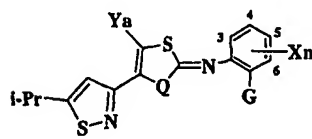
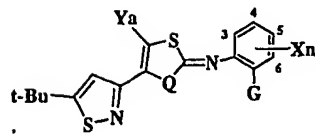
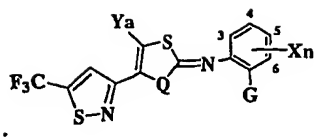
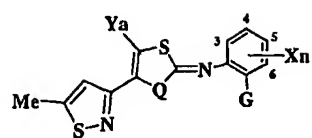


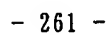


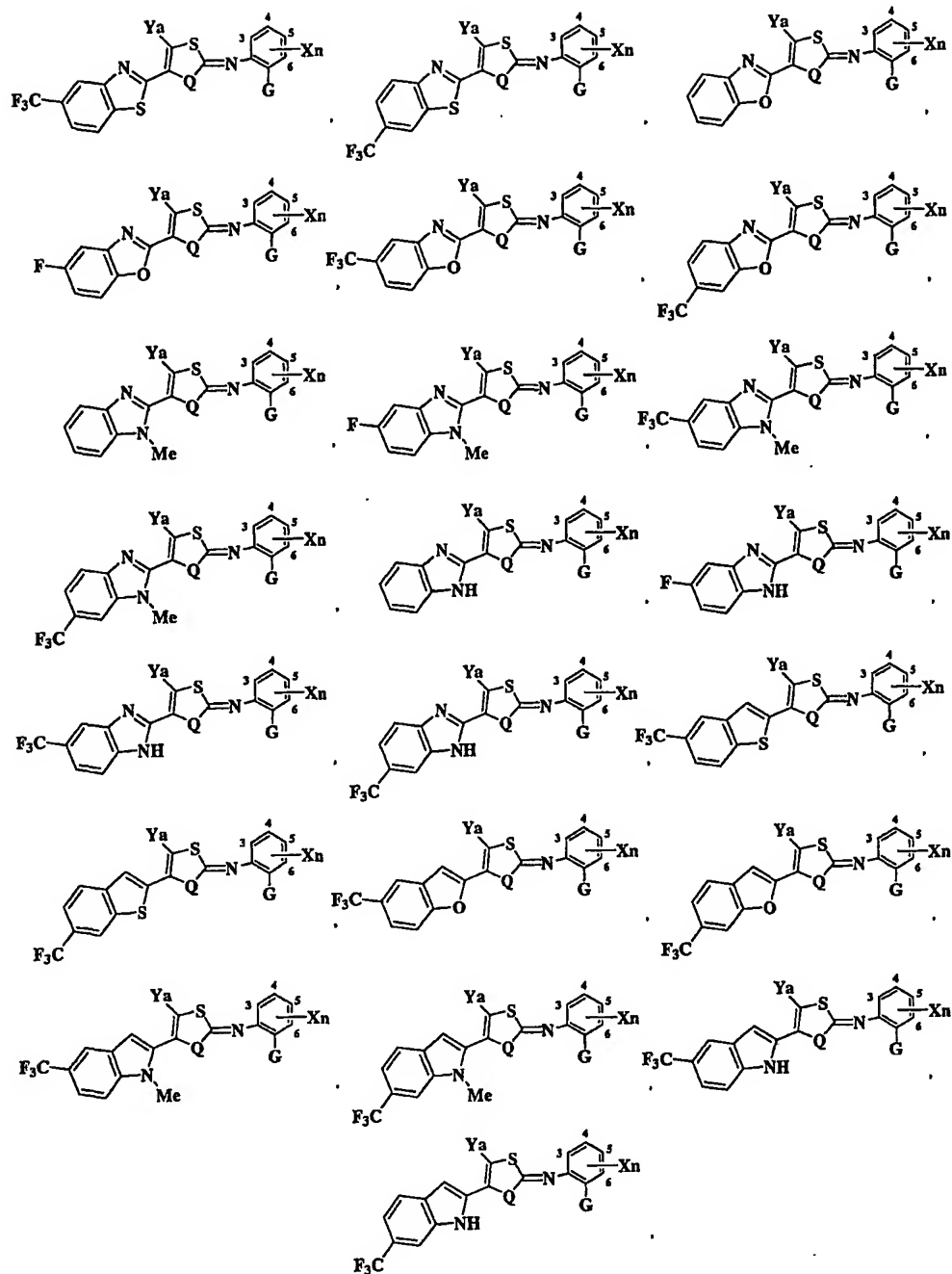


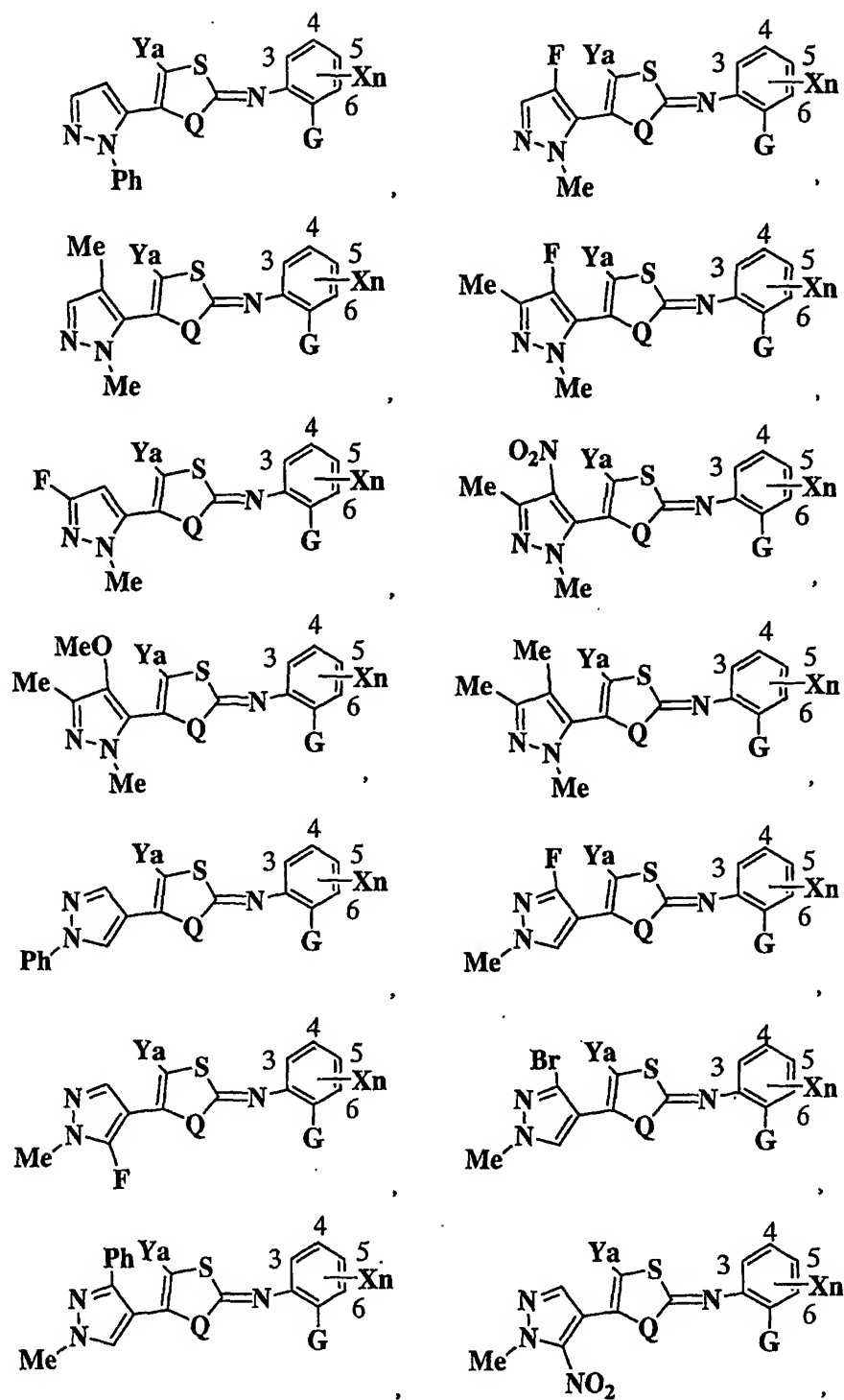












Y a

X n

Q

G

| | | | |
|----|-------------------------|---|----|
| H | H | 0 | G1 |
| H | 3-Me | 0 | G1 |
| H | 4-Me | 0 | G1 |
| H | 5-Me | 0 | G1 |
| H | 6-Me | 0 | G1 |
| H | 4-Et | 0 | G1 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G1 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G1 |
| H | 4-OMe | 0 | G1 |
| H | 6-OMe | 0 | G1 |
| H | 3-F | 0 | G1 |
| H | 4-F | 0 | G1 |
| H | 5-F | 0 | G1 |
| H | 6-F | 0 | G1 |
| H | 4-Cl | 0 | G1 |
| H | 6-Cl | 0 | G1 |
| H | 4-Br | 0 | G1 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G1 |
| Me | H | 0 | G1 |
| Me | 3-Me | 0 | G1 |
| Me | 4-Me | 0 | G1 |
| Me | 5-Me | 0 | G1 |
| Me | 6-Me | 0 | G1 |
| Me | 4-Et | 0 | G1 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G1 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G1 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G1 |
| Me | 4-OMe | 0 | G1 |
| Me | 6-OMe | 0 | G1 |
| Me | 4-OEt | 0 | G1 |
| Me | 4-SMe | 0 | G1 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G1 |
| Me | 3-F | 0 | G1 |
| Me | 4-F | 0 | G1 |
| Me | 5-F | 0 | G1 |
| Me | 6-F | 0 | G1 |
| Me | 4-Cl | 0 | G1 |
| Me | 6-Cl | 0 | G1 |
| Me | 4-Br | 0 | G1 |
| Me | 4-I | 0 | G1 |
| Me | 4-CN | 0 | G1 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | 0 | G1 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | 0 | G1 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | 0 | G1 |
| Et | H | 0 | G1 |
| Et | 4-Me | 0 | G1 |
| Et | 6-Me | 0 | G1 |
| Et | 4-Et | 0 | G1 |
| Et | 4-OMe | 0 | G1 |
| Et | 4-F | 0 | G1 |
| Et | 4-Cl | 0 | G1 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | 0 | G1 |
| Pr | H | 0 | G1 |
| F | H | 0 | G1 |
| Cl | H | 0 | G1 |
| Cl | 4-Me | 0 | G1 |
| Cl | 6-Me | 0 | G1 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| Cl | 4-Et | 0 | G1 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G1 |
| Cl | 4-F | 0 | G1 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G1 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G1 |
| Br | H | 0 | G1 |
| Br | 4-Me | 0 | G1 |
| Br | 6-Me | 0 | G1 |
| Br | 4-Et | 0 | G1 |
| Br | 4-OMe | 0 | G1 |
| Br | 4-F | 0 | G1 |
| Br | 4-Cl | 0 | G1 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G1 |
| H | H | 0 | G2 |
| H | 3-Me | 0 | G2 |
| H | 4-Me | 0 | G2 |
| H | 5-Me | 0 | G2 |
| H | 6-Me | 0 | G2 |
| H | 4-Et | 0 | G2 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G2 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G2 |
| H | 4-OMe | 0 | G2 |
| H | 6-OMe | 0 | G2 |
| H | 3-F | 0 | G2 |
| H | 4-F | 0 | G2 |
| H | 5-F | 0 | G2 |
| H | 6-F | 0 | G2 |
| H | 4-Cl | 0 | G2 |
| H | 6-Cl | 0 | G2 |
| H | 4-Br | 0 | G2 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G2 |
| Me | H | 0 | G2 |
| Me | 3-Me | 0 | G2 |
| Me | 4-Me | 0 | G2 |
| Me | 5-Me | 0 | G2 |
| Me | 6-Me | 0 | G2 |
| Me | 4-Et | 0 | G2 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G2 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G2 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G2 |
| Me | 4-OMe | 0 | G2 |
| Me | 6-OMe | 0 | G2 |
| Me | 4-OEt | 0 | G2 |
| Me | 4-SMe | 0 | G2 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G2 |
| Me | 3-F | 0 | G2 |
| Me | 4-F | 0 | G2 |
| Me | 5-F | 0 | G2 |
| Me | 6-F | 0 | G2 |
| Me | 4-Cl | 0 | G2 |
| Me | 6-Cl | 0 | G2 |
| Me | 4-Br | 0 | G2 |
| Me | 4-I | 0 | G2 |
| Me | 4-CN | 0 | G2 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G2 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G2 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G2 |
| Et | H | 0 | G2 |

| | | | |
|----|---------------------|---|----|
| Et | 4-Me | 0 | G2 |
| Et | 6-Me | 0 | G2 |
| Et | 4-Et | 0 | G2 |
| Et | 4-OMe | 0 | G2 |
| Et | 4-F | 0 | G2 |
| Et | 4-Cl | 0 | G2 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G2 |
| Pr | H | 0 | G2 |
| F | H | 0 | G2 |
| Cl | H | 0 | G2 |
| Cl | 4-Me | 0 | G2 |
| Cl | 6-Me | 0 | G2 |
| Cl | 4-Et | 0 | G2 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G2 |
| Cl | 4-F | 0 | G2 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G2 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G2 |
| Br | H | 0 | G2 |
| Br | 4-Me | 0 | G2 |
| Br | 6-Me | 0 | G2 |
| Br | 4-Et | 0 | G2 |
| Br | 4-OMe | 0 | G2 |
| Br | 4-F | 0 | G2 |
| Br | 4-Cl | 0 | G2 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G2 |
| H | H | 0 | G4 |
| H | 3-Me | 0 | G4 |
| H | 4-Me | 0 | G4 |
| H | 5-Me | 0 | G4 |
| H | 6-Me | 0 | G4 |
| H | 4-Et | 0 | G4 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G4 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G4 |
| H | 4-OMe | 0 | G4 |
| H | 6-OMe | 0 | G4 |
| H | 3-F | 0 | G4 |
| H | 4-F | 0 | G4 |
| H | 5-F | 0 | G4 |
| H | 6-F | 0 | G4 |
| H | 4-Cl | 0 | G4 |
| H | 6-Cl | 0 | G4 |
| H | 4-Br | 0 | G4 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G4 |
| Me | H | 0 | G4 |
| Me | 3-Me | 0 | G4 |
| Me | 4-Me | 0 | G4 |
| Me | 5-Me | 0 | G4 |
| Me | 6-Me | 0 | G4 |
| Me | 4-Et | 0 | G4 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G4 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G4 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G4 |
| Me | 4-OMe | 0 | G4 |
| Me | 6-OMe | 0 | G4 |
| Me | 4-OEt | 0 | G4 |
| Me | 4-SMe | 0 | G4 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G4 |
| Me | 3-F | 0 | G4 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| Me | 4-F | 0 | G4 |
| Me | 5-F | 0 | G4 |
| Me | 6-F | 0 | G4 |
| Me | 4-Cl | 0 | G4 |
| Me | 6-Cl | 0 | G4 |
| Me | 4-Br | 0 | G4 |
| Me | 4-I | 0 | G4 |
| Me | 4-CN | 0 | G4 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G4 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G4 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G4 |
| Et | H | 0 | G4 |
| Et | 4-Me | 0 | G4 |
| Et | 6-Me | 0 | G4 |
| Et | 4-Et | 0 | G4 |
| Et | 4-OMe | 0 | G4 |
| Et | 4-F | 0 | G4 |
| Et | 4-Cl | 0 | G4 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G4 |
| Pr | H | 0 | G4 |
| F | H | 0 | G4 |
| Cl | H | 0 | G4 |
| Cl | 4-Me | 0 | G4 |
| Cl | 6-Me | 0 | G4 |
| Cl | 4-Et | 0 | G4 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G4 |
| Cl | 4-F | 0 | G4 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G4 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G4 |
| Br | H | 0 | G4 |
| Br | 4-Me | 0 | G4 |
| Br | 6-Me | 0 | G4 |
| Br | 4-Et | 0 | G4 |
| Br | 4-OMe | 0 | G4 |
| Br | 4-F | 0 | G4 |
| Br | 4-Cl | 0 | G4 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G4 |
| H | H | 0 | G5 |
| H | 3-Me | 0 | G5 |
| H | 4-Me | 0 | G5 |
| H | 5-Me | 0 | G5 |
| H | 6-Me | 0 | G5 |
| H | 4-Et | 0 | G5 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G5 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G5 |
| H | 4-OMe | 0 | G5 |
| H | 6-OMe | 0 | G5 |
| H | 3-F | 0 | G5 |
| H | 4-F | 0 | G5 |
| H | 5-F | 0 | G5 |
| H | 6-F | 0 | G5 |
| H | 4-Cl | 0 | G5 |
| H | 6-Cl | 0 | G5 |
| H | 4-Br | 0 | G5 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G5 |
| Me | H | 0 | G5 |
| Me | 3-Me | 0 | G5 |
| Me | 4-Me | 0 | G5 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| Me | 5-Me | 0 | G5 |
| Me | 6-Me | 0 | G5 |
| Me | 4-Et | 0 | G5 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G5 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G5 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G5 |
| Me | 4-OMe | 0 | G5 |
| Me | 6-OMe | 0 | G5 |
| Me | 4-OEt | 0 | G5 |
| Me | 4-SMe | 0 | G5 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G5 |
| Me | 3-F | 0 | G5 |
| Me | 4-F | 0 | G5 |
| Me | 5-F | 0 | G5 |
| Me | 6-F | 0 | G5 |
| Me | 4-Cl | 0 | G5 |
| Me | 6-Cl | 0 | G5 |
| Me | 4-Br | 0 | G5 |
| Me | 4-I | 0 | G5 |
| Me | 4-CN | 0 | G5 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G5 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G5 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G5 |
| Et | H | 0 | G5 |
| Et | 4-Me | 0 | G5 |
| Et | 6-Me | 0 | G5 |
| Et | 4-Et | 0 | G5 |
| Et | 4-OMe | 0 | G5 |
| Et | 4-F | 0 | G5 |
| Et | 4-Cl | 0 | G5 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G5 |
| Pr | H | 0 | G5 |
| F | H | 0 | G5 |
| Cl | H | 0 | G5 |
| Cl | 4-Me | 0 | G5 |
| Cl | 6-Me | 0 | G5 |
| Cl | 4-Et | 0 | G5 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G5 |
| Cl | 4-F | 0 | G5 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G5 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G5 |
| Br | H | 0 | G5 |
| Br | 4-Me | 0 | G5 |
| Br | 6-Me | 0 | G5 |
| Br | 4-Et | 0 | G5 |
| Br | 4-OMe | 0 | G5 |
| Br | 4-F | 0 | G5 |
| Br | 4-Cl | 0 | G5 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G5 |
| H | H | 0 | G6 |
| H | 3-Me | 0 | G6 |
| H | 4-Me | 0 | G6 |
| H | 5-Me | 0 | G6 |
| H | 6-Me | 0 | G6 |
| H | 4-Et | 0 | G6 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G6 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G6 |
| H | 4-OMe | 0 | G6 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|----|
| H | 6-OMe | 0 | G6 |
| H | 3-F | 0 | G6 |
| H | 4-F | 0 | G6 |
| H | 5-F | 0 | G6 |
| H | 6-F | 0 | G6 |
| H | 4-Cl | 0 | G6 |
| H | 6-Cl | 0 | G6 |
| H | 4-Br | 0 | G6 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G6 |
| Me | H | 0 | G6 |
| Me | 3-Me | 0 | G6 |
| Me | 4-Me | 0 | G6 |
| Me | 5-Me | 0 | G6 |
| Me | 6-Me | 0 | G6 |
| Me | 4-Et | 0 | G6 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G6 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G6 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G6 |
| Me | 4-OMe | 0 | G6 |
| Me | 6-OMe | 0 | G6 |
| Me | 4-OEt | 0 | G6 |
| Me | 4-SMe | 0 | G6 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G6 |
| Me | 3-F | 0 | G6 |
| Me | 4-F | 0 | G6 |
| Me | 5-F | 0 | G6 |
| Me | 6-F | 0 | G6 |
| Me | 4-Cl | 0 | G6 |
| Me | 6-Cl | 0 | G6 |
| Me | 4-Br | 0 | G6 |
| Me | 4-I | 0 | G6 |
| Me | 4-CN | 0 | G6 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | 0 | G6 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | 0 | G6 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | 0 | G6 |
| Et | H | 0 | G6 |
| Et | 4-Me | 0 | G6 |
| Et | 6-Me | 0 | G6 |
| Et | 4-Et | 0 | G6 |
| Et | 4-OMe | 0 | G6 |
| Et | 4-F | 0 | G6 |
| Et | 4-Cl | 0 | G6 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | 0 | G6 |
| Pr | H | 0 | G6 |
| F | H | 0 | G6 |
| Cl | H | 0 | G6 |
| Cl | 4-Me | 0 | G6 |
| Cl | 6-Me | 0 | G6 |
| Cl | 4-Et | 0 | G6 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G6 |
| Cl | 4-F | 0 | G6 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G6 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | 0 | G6 |
| Br | H | 0 | G6 |
| Br | 4-Me | 0 | G6 |
| Br | 6-Me | 0 | G6 |
| Br | 4-Et | 0 | G6 |
| Br | 4-OMe | 0 | G6 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| Br | 4-F | 0 | G6 |
| Br | 4-Cl | 0 | G6 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | 0 | G6 |
| H | H | 0 | G11 |
| H | 3-Me | 0 | G11 |
| H | 4-Me | 0 | G11 |
| H | 5-Me | 0 | G11 |
| H | 6-Me | 0 | G11 |
| H | 4-Et | 0 | G11 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G11 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G11 |
| H | 4-OMe | 0 | G11 |
| H | 6-OMe | 0 | G11 |
| H | 3-F | 0 | G11 |
| H | 4-F | 0 | G11 |
| H | 5-F | 0 | G11 |
| H | 6-F | 0 | G11 |
| H | 4-Cl | 0 | G11 |
| H | 6-Cl | 0 | G11 |
| H | 4-Br | 0 | G11 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G11 |
| Me | H | 0 | G11 |
| Me | 3-Me | 0 | G11 |
| Me | 4-Me | 0 | G11 |
| Me | 5-Me | 0 | G11 |
| Me | 6-Me | 0 | G11 |
| Me | 4-Et | 0 | G11 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G11 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G11 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G11 |
| Me | 4-OMe | 0 | G11 |
| Me | 6-OMe | 0 | G11 |
| Me | 4-OEt | 0 | G11 |
| Me | 4-SMe | 0 | G11 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G11 |
| Me | 3-F | 0 | G11 |
| Me | 4-F | 0 | G11 |
| Me | 5-F | 0 | G11 |
| Me | 6-F | 0 | G11 |
| Me | 4-Cl | 0 | G11 |
| Me | 6-Cl | 0 | G11 |
| Me | 4-Br | 0 | G11 |
| Me | 4-I | 0 | G11 |
| Me | 4-CN | 0 | G11 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | 0 | G11 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | 0 | G11 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | 0 | G11 |
| Et | H | 0 | G11 |
| Et | 4-Me | 0 | G11 |
| Et | 6-Me | 0 | G11 |
| Et | 4-Et | 0 | G11 |
| Et | 4-OMe | 0 | G11 |
| Et | 4-F | 0 | G11 |
| Et | 4-Cl | 0 | G11 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | 0 | G11 |
| Pr | H | 0 | G11 |
| F | H | 0 | G11 |
| Cl | H | 0 | G11 |

| | | | |
|----|----------------------|---|-----|
| Cl | 4-Me | 0 | G11 |
| Cl | 6-Me | 0 | G11 |
| Cl | 4-Et | 0 | G11 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G11 |
| Cl | 4-F | 0 | G11 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G11 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | 0 | G11 |
| Br | H | 0 | G11 |
| Br | 4-Me | 0 | G11 |
| Br | 6-Me | 0 | G11 |
| Br | 4-Et | 0 | G11 |
| Br | 4-OMe | 0 | G11 |
| Br | 4-F | 0 | G11 |
| Br | 4-Cl | 0 | G11 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | 0 | G11 |
| H | H | 0 | G12 |
| H | 3-Me | 0 | G12 |
| H | 4-Me | 0 | G12 |
| H | 5-Me | 0 | G12 |
| H | 6-Me | 0 | G12 |
| H | 4-Et | 0 | G12 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G12 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G12 |
| H | 4-OMe | 0 | G12 |
| H | 6-OMe | 0 | G12 |
| H | 3-F | 0 | G12 |
| H | 4-F | 0 | G12 |
| H | 5-F | 0 | G12 |
| H | 6-F | 0 | G12 |
| H | 4-Cl | 0 | G12 |
| H | 6-Cl | 0 | G12 |
| H | 4-Br | 0 | G12 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G12 |
| Me | H | 0 | G12 |
| Me | 3-Me | 0 | G12 |
| Me | 4-Me | 0 | G12 |
| Me | 5-Me | 0 | G12 |
| Me | 6-Me | 0 | G12 |
| Me | 4-Et | 0 | G12 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G12 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G12 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G12 |
| Me | 4-OMe | 0 | G12 |
| Me | 6-OMe | 0 | G12 |
| Me | 4-OEt | 0 | G12 |
| Me | 4-SMe | 0 | G12 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G12 |
| Me | 3-F | 0 | G12 |
| Me | 4-F | 0 | G12 |
| Me | 5-F | 0 | G12 |
| Me | 6-F | 0 | G12 |
| Me | 4-Cl | 0 | G12 |
| Me | 6-Cl | 0 | G12 |
| Me | 4-Br | 0 | G12 |
| Me | 4-I | 0 | G12 |
| Me | 4-CN | 0 | G12 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | 0 | G12 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | 0 | G12 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | 0 | G12 |
| Et | H | 0 | G12 |
| Et | 4-Me | 0 | G12 |
| Et | 6-Me | 0 | G12 |
| Et | 4-Et | 0 | G12 |
| Et | 4-OMe | 0 | G12 |
| Et | 4-F | 0 | G12 |
| Et | 4-Cl | 0 | G12 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | 0 | G12 |
| Pr | H | 0 | G12 |
| F | H | 0 | G12 |
| Cl | H | 0 | G12 |
| Cl | 4-Me | 0 | G12 |
| Cl | 6-Me | 0 | G12 |
| Cl | 4-Et | 0 | G12 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G12 |
| Cl | 4-F | 0 | G12 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G12 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | 0 | G12 |
| Br | H | 0 | G12 |
| Br | 4-Me | 0 | G12 |
| Br | 6-Me | 0 | G12 |
| Br | 4-Et | 0 | G12 |
| Br | 4-OMe | 0 | G12 |
| Br | 4-F | 0 | G12 |
| Br | 4-Cl | 0 | G12 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | 0 | G12 |
| H | H | 0 | G13 |
| H | 3-Me | 0 | G13 |
| H | 4-Me | 0 | G13 |
| H | 5-Me | 0 | G13 |
| H | 6-Me | 0 | G13 |
| H | 4-Et | 0 | G13 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G13 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G13 |
| H | 4-OMe | 0 | G13 |
| H | 6-OMe | 0 | G13 |
| H | 3-F | 0 | G13 |
| H | 4-F | 0 | G13 |
| H | 5-F | 0 | G13 |
| H | 6-F | 0 | G13 |
| H | 4-Cl | 0 | G13 |
| H | 6-Cl | 0 | G13 |
| H | 4-Br | 0 | G13 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G13 |
| Me | H | 0 | G13 |
| Me | 3-Me | 0 | G13 |
| Me | 4-Me | 0 | G13 |
| Me | 5-Me | 0 | G13 |
| Me | 6-Me | 0 | G13 |
| Me | 4-Et | 0 | G13 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G13 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G13 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G13 |
| Me | 4-OMe | 0 | G13 |
| Me | 6-OMe | 0 | G13 |
| Me | 4-OEt | 0 | G13 |
| Me | 4-SMe | 0 | G13 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G13 |
| Me | 3-F | 0 | G13 |
| Me | 4-F | 0 | G13 |
| Me | 5-F | 0 | G13 |
| Me | 6-F | 0 | G13 |
| Me | 4-Cl | 0 | G13 |
| Me | 6-Cl | 0 | G13 |
| Me | 4-Br | 0 | G13 |
| Me | 4-I | 0 | G13 |
| Me | 4-CN | 0 | G13 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G13 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G13 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G13 |
| Et | H | 0 | G13 |
| Et | 4-Me | 0 | G13 |
| Et | 6-Me | 0 | G13 |
| Et | 4-Et | 0 | G13 |
| Et | 4-OMe | 0 | G13 |
| Et | 4-F | 0 | G13 |
| Et | 4-Cl | 0 | G13 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G13 |
| Pr | H | 0 | G13 |
| F | H | 0 | G13 |
| Cl | H | 0 | G13 |
| Cl | 4-Me | 0 | G13 |
| Cl | 6-Me | 0 | G13 |
| Cl | 4-Et | 0 | G13 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G13 |
| Cl | 4-F | 0 | G13 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G13 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G13 |
| Br | H | 0 | G13 |
| Br | 4-Me | 0 | G13 |
| Br | 6-Me | 0 | G13 |
| Br | 4-Et | 0 | G13 |
| Br | 4-OMe | 0 | G13 |
| Br | 4-F | 0 | G13 |
| Br | 4-Cl | 0 | G13 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G13 |
| H | H | 0 | G14 |
| H | 3-Me | 0 | G14 |
| H | 4-Me | 0 | G14 |
| H | 5-Me | 0 | G14 |
| H | 6-Me | 0 | G14 |
| H | 4-Et | 0 | G14 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G14 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G14 |
| H | 4-OMe | 0 | G14 |
| H | 6-OMe | 0 | G14 |
| H | 3-F | 0 | G14 |
| H | 4-F | 0 | G14 |
| H | 5-F | 0 | G14 |
| H | 6-F | 0 | G14 |
| H | 4-Cl | 0 | G14 |
| H | 6-Cl | 0 | G14 |
| H | 4-Br | 0 | G14 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G14 |
| Me | H | 0 | G14 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Me | 3-Me | 0 | G14 |
| Me | 4-Me | 0 | G14 |
| Me | 5-Me | 0 | G14 |
| Me | 6-Me | 0 | G14 |
| Me | 4-Et | 0 | G14 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G14 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G14 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G14 |
| Me | 4-OMe | 0 | G14 |
| Me | 6-OMe | 0 | G14 |
| Me | 4-OEt | 0 | G14 |
| Me | 4-SMe | 0 | G14 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G14 |
| Me | 3-F | 0 | G14 |
| Me | 4-F | 0 | G14 |
| Me | 5-F | 0 | G14 |
| Me | 6-F | 0 | G14 |
| Me | 4-Cl | 0 | G14 |
| Me | 6-Cl | 0 | G14 |
| Me | 4-Br | 0 | G14 |
| Me | 4-I | 0 | G14 |
| Me | 4-CN | 0 | G14 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G14 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G14 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G14 |
| Et | H | 0 | G14 |
| Et | 4-Me | 0 | G14 |
| Et | 6-Me | 0 | G14 |
| Et | 4-Et | 0 | G14 |
| Et | 4-OMe | 0 | G14 |
| Et | 4-F | 0 | G14 |
| Et | 4-Cl | 0 | G14 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G14 |
| Pr | H | 0 | G14 |
| F | H | 0 | G14 |
| Cl | H | 0 | G14 |
| Cl | 4-Me | 0 | G14 |
| Cl | 6-Me | 0 | G14 |
| Cl | 4-Et | 0 | G14 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G14 |
| Cl | 4-F | 0 | G14 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G14 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G14 |
| Br | H | 0 | G14 |
| Br | 4-Me | 0 | G14 |
| Br | 6-Me | 0 | G14 |
| Br | 4-Et | 0 | G14 |
| Br | 4-OMe | 0 | G14 |
| Br | 4-F | 0 | G14 |
| Br | 4-Cl | 0 | G14 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G14 |
| H | H | 0 | G15 |
| H | 3-Me | 0 | G15 |
| H | 4-Me | 0 | G15 |
| H | 5-Me | 0 | G15 |
| H | 6-Me | 0 | G15 |
| H | 4-Et | 0 | G15 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G15 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| H | 4-i-Pr | 0 | G15 |
| H | 4-OMe | 0 | G15 |
| H | 6-OMe | 0 | G15 |
| H | 3-F | 0 | G15 |
| H | 4-F | 0 | G15 |
| H | 5-F | 0 | G15 |
| H | 6-F | 0 | G15 |
| H | 4-Cl | 0 | G15 |
| H | 6-Cl | 0 | G15 |
| H | 4-Br | 0 | G15 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G15 |
| Me | H | 0 | G15 |
| Me | 3-Me | 0 | G15 |
| Me | 4-Me | 0 | G15 |
| Me | 5-Me | 0 | G15 |
| Me | 6-Me | 0 | G15 |
| Me | 4-Et | 0 | G15 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G15 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G15 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G15 |
| Me | 4-OMe | 0 | G15 |
| Me | 6-OMe | 0 | G15 |
| Me | 4-OEt | 0 | G15 |
| Me | 4-SMe | 0 | G15 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G15 |
| Me | 3-F | 0 | G15 |
| Me | 4-F | 0 | G15 |
| Me | 5-F | 0 | G15 |
| Me | 6-F | 0 | G15 |
| Me | 4-Cl | 0 | G15 |
| Me | 6-Cl | 0 | G15 |
| Me | 4-Br | 0 | G15 |
| Me | 4-I | 0 | G15 |
| Me | 4-CN | 0 | G15 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G15 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G15 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G15 |
| Et | H | 0 | G15 |
| Et | 4-Me | 0 | G15 |
| Et | 6-Me | 0 | G15 |
| Et | 4-Et | 0 | G15 |
| Et | 4-OMe | 0 | G15 |
| Et | 4-F | 0 | G15 |
| Et | 4-Cl | 0 | G15 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G15 |
| Pr | H | 0 | G15 |
| F | H | 0 | G15 |
| Cl | H | 0 | G15 |
| Cl | 4-Me | 0 | G15 |
| Cl | 6-Me | 0 | G15 |
| Cl | 4-Et | 0 | G15 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G15 |
| Cl | 4-F | 0 | G15 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G15 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | 0 | G15 |
| Br | H | 0 | G15 |
| Br | 4-Me | 0 | G15 |
| Br | 6-Me | 0 | G15 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Br | 4-Et | 0 | G15 |
| Br | 4-OMe | 0 | G15 |
| Br | 4-F | 0 | G15 |
| Br | 4-Cl | 0 | G15 |
| Br | 4,6-Me ₂ | 0 | G15 |
| H | H | 0 | G16 |
| H | 3-Me | 0 | G16 |
| H | 4-Me | 0 | G16 |
| H | 5-Me | 0 | G16 |
| H | 6-Me | 0 | G16 |
| H | 4-Et | 0 | G16 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G16 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G16 |
| H | 4-OMe | 0 | G16 |
| H | 6-OMe | 0 | G16 |
| H | 3-F | 0 | G16 |
| H | 4-F | 0 | G16 |
| H | 5-F | 0 | G16 |
| H | 6-F | 0 | G16 |
| H | 4-Cl | 0 | G16 |
| H | 6-Cl | 0 | G16 |
| H | 4-Br | 0 | G16 |
| H | 4,6-Me ₂ | 0 | G16 |
| Me | H | 0 | G16 |
| Me | 3-Me | 0 | G16 |
| Me | 4-Me | 0 | G16 |
| Me | 5-Me | 0 | G16 |
| Me | 6-Me | 0 | G16 |
| Me | 4-Et | 0 | G16 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G16 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G16 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G16 |
| Me | 4-OMe | 0 | G16 |
| Me | 6-OMe | 0 | G16 |
| Me | 4-OEt | 0 | G16 |
| Me | 4-SMe | 0 | G16 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G16 |
| Me | 3-F | 0 | G16 |
| Me | 4-F | 0 | G16 |
| Me | 5-F | 0 | G16 |
| Me | 6-F | 0 | G16 |
| Me | 4-Cl | 0 | G16 |
| Me | 6-Cl | 0 | G16 |
| Me | 4-Br | 0 | G16 |
| Me | 4-I | 0 | G16 |
| Me | 4-CN | 0 | G16 |
| Me | 4,5-Me ₂ | 0 | G16 |
| Me | 4,6-Me ₂ | 0 | G16 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | 0 | G16 |
| Et | H | 0 | G16 |
| Et | 4-Me | 0 | G16 |
| Et | 6-Me | 0 | G16 |
| Et | 4-Et | 0 | G16 |
| Et | 4-OMe | 0 | G16 |
| Et | 4-F | 0 | G16 |
| Et | 4-Cl | 0 | G16 |
| Et | 4,6-Me ₂ | 0 | G16 |
| Pr | H | 0 | G16 |

| | | | |
|----|----------------------|---|-----|
| F | H | 0 | G16 |
| Cl | H | 0 | G16 |
| Cl | 4-Me | 0 | G16 |
| Cl | 6-Me | 0 | G16 |
| Cl | 4-Et | 0 | G16 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G16 |
| Cl | 4-F | 0 | G16 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G16 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | 0 | G16 |
| Br | H | 0 | G16 |
| Br | 4-Me | 0 | G16 |
| Br | 6-Me | 0 | G16 |
| Br | 4-Et | 0 | G16 |
| Br | 4-OMe | 0 | G16 |
| Br | 4-F | 0 | G16 |
| Br | 4-Cl | 0 | G16 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | 0 | G16 |
| H | H | 0 | G17 |
| H | 3-Me | 0 | G17 |
| H | 4-Me | 0 | G17 |
| H | 5-Me | 0 | G17 |
| H | 6-Me | 0 | G17 |
| H | 4-Et | 0 | G17 |
| H | 4-t-Bu | 0 | G17 |
| H | 4-i-Pr | 0 | G17 |
| H | 4-OMe | 0 | G17 |
| H | 6-OMe | 0 | G17 |
| H | 3-F | 0 | G17 |
| H | 4-F | 0 | G17 |
| H | 5-F | 0 | G17 |
| H | 6-F | 0 | G17 |
| H | 4-Cl | 0 | G17 |
| H | 6-Cl | 0 | G17 |
| H | 4-Br | 0 | G17 |
| H | 4, 6-Me ₂ | 0 | G17 |
| Me | H | 0 | G17 |
| Me | 3-Me | 0 | G17 |
| Me | 4-Me | 0 | G17 |
| Me | 5-Me | 0 | G17 |
| Me | 6-Me | 0 | G17 |
| Me | 4-Et | 0 | G17 |
| Me | 4-t-Bu | 0 | G17 |
| Me | 4-i-Pr | 0 | G17 |
| Me | 4-CF ₃ | 0 | G17 |
| Me | 4-OMe | 0 | G17 |
| Me | 6-OMe | 0 | G17 |
| Me | 4-OEt | 0 | G17 |
| Me | 4-SMe | 0 | G17 |
| Me | 4-NMe ₂ | 0 | G17 |
| Me | 3-F | 0 | G17 |
| Me | 4-F | 0 | G17 |
| Me | 5-F | 0 | G17 |
| Me | 6-F | 0 | G17 |
| Me | 4-Cl | 0 | G17 |
| Me | 6-Cl | 0 | G17 |
| Me | 4-Br | 0 | G17 |
| Me | 4-I | 0 | G17 |
| Me | 4-CN | 0 | G17 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| Me | 4, 5-Me ₂ | 0 | G17 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | 0 | G17 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | 0 | G17 |
| Et | H | 0 | G17 |
| Et | 4-Me | 0 | G17 |
| Et | 6-Me | 0 | G17 |
| Et | 4-Et | 0 | G17 |
| Et | 4-OMe | 0 | G17 |
| Et | 4-F | 0 | G17 |
| Et | 4-Cl | 0 | G17 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | 0 | G17 |
| Pr | H | 0 | G17 |
| F | H | 0 | G17 |
| Cl | H | 0 | G17 |
| Cl | 4-Me | 0 | G17 |
| Cl | 6-Me | 0 | G17 |
| Cl | 4-Et | 0 | G17 |
| Cl | 4-OMe | 0 | G17 |
| Cl | 4-F | 0 | G17 |
| Cl | 4-Cl | 0 | G17 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | 0 | G17 |
| Br | H | 0 | G17 |
| Br | 4-Me | 0 | G17 |
| Br | 6-Me | 0 | G17 |
| Br | 4-Et | 0 | G17 |
| Br | 4-OMe | 0 | G17 |
| Br | 4-F | 0 | G17 |
| Br | 4-Cl | 0 | G17 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | 0 | G17 |
| H | H | S | G1 |
| H | 3-Me | S | G1 |
| H | 4-Me | S | G1 |
| H | 5-Me | S | G1 |
| H | 6-Me | S | G1 |
| H | 4-Et | S | G1 |
| H | 4-t-Bu | S | G1 |
| H | 4-i-Pr | S | G1 |
| H | 4-OMe | S | G1 |
| H | 6-OMe | S | G1 |
| H | 3-F | S | G1 |
| H | 4-F | S | G1 |
| H | 5-F | S | G1 |
| H | 6-F | S | G1 |
| H | 4-Cl | S | G1 |
| H | 6-Cl | S | G1 |
| H | 4-Br | S | G1 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G1 |
| Me | H | S | G1 |
| Me | 3-Me | S | G1 |
| Me | 4-Me | S | G1 |
| Me | 5-Me | S | G1 |
| Me | 6-Me | S | G1 |
| Me | 4-Et | S | G1 |
| Me | 4-t-Bu | S | G1 |
| Me | 4-i-Pr | S | G1 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G1 |
| Me | 4-OMe | S | G1 |
| Me | 6-OMe | S | G1 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| Me | 4-OEt | S | G1 |
| Me | 4-SMe | S | G1 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G1 |
| Me | 3-F | S | G1 |
| Me | 4-F | S | G1 |
| Me | 5-F | S | G1 |
| Me | 6-F | S | G1 |
| Me | 4-Cl | S | G1 |
| Me | 6-Cl | S | G1 |
| Me | 4-Br | S | G1 |
| Me | 4-I | S | G1 |
| Me | 4-CN | S | G1 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G1 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G1 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G1 |
| Et | H | S | G1 |
| Et | 4-Me | S | G1 |
| Et | 6-Me | S | G1 |
| Et | 4-Et | S | G1 |
| Et | 4-OMe | S | G1 |
| Et | 4-F | S | G1 |
| Et | 4-Cl | S | G1 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G1 |
| Pr | H | S | G1 |
| F | H | S | G1 |
| Cl | H | S | G1 |
| Cl | 4-Me | S | G1 |
| Cl | 6-Me | S | G1 |
| Cl | 4-Et | S | G1 |
| Cl | 4-OMe | S | G1 |
| Cl | 4-F | S | G1 |
| Cl | 4-Cl | S | G1 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G1 |
| Br | H | S | G1 |
| Br | 4-Me | S | G1 |
| Br | 6-Me | S | G1 |
| Br | 4-Et | S | G1 |
| Br | 4-OMe | S | G1 |
| Br | 4-F | S | G1 |
| Br | 4-Cl | S | G1 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G1 |
| H | H | S | G2 |
| H | 3-Me | S | G2 |
| H | 4-Me | S | G2 |
| H | 5-Me | S | G2 |
| H | 6-Me | S | G2 |
| H | 4-Et | S | G2 |
| H | 4-t-Bu | S | G2 |
| H | 4-i-Pr | S | G2 |
| H | 4-OMe | S | G2 |
| H | 6-OMe | S | G2 |
| H | 3-F | S | G2 |
| H | 4-F | S | G2 |
| H | 5-F | S | G2 |
| H | 6-F | S | G2 |
| H | 4-Cl | S | G2 |
| H | 6-Cl | S | G2 |
| H | 4-Br | S | G2 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|----|
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G2 |
| Me | H | S | G2 |
| Me | 3-Me | S | G2 |
| Me | 4-Me | S | G2 |
| Me | 5-Me | S | G2 |
| Me | 6-Me | S | G2 |
| Me | 4-Et | S | G2 |
| Me | 4-t-Bu | S | G2 |
| Me | 4-i-Pr | S | G2 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G2 |
| Me | 4-OMe | S | G2 |
| Me | 6-OMe | S | G2 |
| Me | 4-OEt | S | G2 |
| Me | 4-SMe | S | G2 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G2 |
| Me | 3-F | S | G2 |
| Me | 4-F | S | G2 |
| Me | 5-F | S | G2 |
| Me | 6-F | S | G2 |
| Me | 4-Cl | S | G2 |
| Me | 6-Cl | S | G2 |
| Me | 4-Br | S | G2 |
| Me | 4-I | S | G2 |
| Me | 4-CN | S | G2 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | S | G2 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | S | G2 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | S | G2 |
| Et | H | S | G2 |
| Et | 4-Me | S | G2 |
| Et | 6-Me | S | G2 |
| Et | 4-Et | S | G2 |
| Et | 4-OMe | S | G2 |
| Et | 4-F | S | G2 |
| Et | 4-Cl | S | G2 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | S | G2 |
| Pr | H | S | G2 |
| F | H | S | G2 |
| Cl | H | S | G2 |
| Cl | 4-Me | S | G2 |
| Cl | 6-Me | S | G2 |
| Cl | 4-Et | S | G2 |
| Cl | 4-OMe | S | G2 |
| Cl | 4-F | S | G2 |
| Cl | 4-Cl | S | G2 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G2 |
| Br | H | S | G2 |
| Br | 4-Me | S | G2 |
| Br | 6-Me | S | G2 |
| Br | 4-Et | S | G2 |
| Br | 4-OMe | S | G2 |
| Br | 4-F | S | G2 |
| Br | 4-Cl | S | G2 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G2 |
| H | H | S | G4 |
| H | 3-Me | S | G4 |
| H | 4-Me | S | G4 |
| H | 5-Me | S | G4 |
| H | 6-Me | S | G4 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| H | 4-Et | S | G4 |
| H | 4-t-Bu | S | G4 |
| H | 4-i-Pr | S | G4 |
| H | 4-OMe | S | G4 |
| H | 6-OMe | S | G4 |
| H | 3-F | S | G4 |
| H | 4-F | S | G4 |
| H | 5-F | S | G4 |
| H | 6-F | S | G4 |
| H | 4-Cl | S | G4 |
| H | 6-Cl | S | G4 |
| H | 4-Br | S | G4 |
| H | 4,6-Me ₂ | S | G4 |
| Me | H | S | G4 |
| Me | 3-Me | S | G4 |
| Me | 4-Me | S | G4 |
| Me | 5-Me | S | G4 |
| Me | 6-Me | S | G4 |
| Me | 4-Et | S | G4 |
| Me | 4-t-Bu | S | G4 |
| Me | 4-i-Pr | S | G4 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G4 |
| Me | 4-OMe | S | G4 |
| Me | 6-OMe | S | G4 |
| Me | 4-OEt | S | G4 |
| Me | 4-SMe | S | G4 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G4 |
| Me | 3-F | S | G4 |
| Me | 4-F | S | G4 |
| Me | 5-F | S | G4 |
| Me | 6-F | S | G4 |
| Me | 4-Cl | S | G4 |
| Me | 6-Cl | S | G4 |
| Me | 4-Br | S | G4 |
| Me | 4-I | S | G4 |
| Me | 4-CN | S | G4 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G4 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G4 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G4 |
| Et | H | S | G4 |
| Et | 4-Me | S | G4 |
| Et | 6-Me | S | G4 |
| Et | 4-Et | S | G4 |
| Et | 4-OMe | S | G4 |
| Et | 4-F | S | G4 |
| Et | 4-Cl | S | G4 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G4 |
| Pr | H | S | G4 |
| F | H | S | G4 |
| Cl | H | S | G4 |
| Cl | 4-Me | S | G4 |
| Cl | 6-Me | S | G4 |
| Cl | 4-Et | S | G4 |
| Cl | 4-OMe | S | G4 |
| Cl | 4-F | S | G4 |
| Cl | 4-Cl | S | G4 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G4 |
| Br | H | S | G4 |

| | | | |
|----|------------------------|---|----|
| Br | 4-Me | S | G4 |
| Br | 6-Me | S | G4 |
| Br | 4-Et | S | G4 |
| Br | 4-OMe | S | G4 |
| Br | 4-F | S | G4 |
| Br | 4-Cl | S | G4 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G4 |
| H | H | S | G5 |
| H | 3-Me | S | G5 |
| H | 4-Me | S | G5 |
| H | 5-Me | S | G5 |
| H | 6-Me | S | G5 |
| H | 4-Et | S | G5 |
| H | 4-t-Bu | S | G5 |
| H | 4-i-Pr | S | G5 |
| H | 4-OMe | S | G5 |
| H | 6-OMe | S | G5 |
| H | 3-F | S | G5 |
| H | 4-F | S | G5 |
| H | 5-F | S | G5 |
| H | 6-F | S | G5 |
| H | 4-Cl | S | G5 |
| H | 6-Cl | S | G5 |
| H | 4-Br | S | G5 |
| H | 4,6-Me ₂ | S | G5 |
| Me | H | S | G5 |
| Me | 3-Me | S | G5 |
| Me | 4-Me | S | G5 |
| Me | 5-Me | S | G5 |
| Me | 6-Me | S | G5 |
| Me | 4-Et | S | G5 |
| Me | 4-t-Bu | S | G5 |
| Me | 4-i-Pr | S | G5 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G5 |
| Me | 4-OMe | S | G5 |
| Me | 6-OMe | S | G5 |
| Me | 4-OEt | S | G5 |
| Me | 4-SMe | S | G5 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G5 |
| Me | 3-F | S | G5 |
| Me | 4-F | S | G5 |
| Me | 5-F | S | G5 |
| Me | 6-F | S | G5 |
| Me | 4-Cl | S | G5 |
| Me | 6-Cl | S | G5 |
| Me | 4-Br | S | G5 |
| Me | 4-I | S | G5 |
| Me | 4-CN | S | G5 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G5 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G5 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G5 |
| Et | H | S | G5 |
| Et | 4-Me | S | G5 |
| Et | 6-Me | S | G5 |
| Et | 4-Et | S | G5 |
| Et | 4-OMe | S | G5 |
| Et | 4-F | S | G5 |
| Et | 4-Cl | S | G5 |

| | | | |
|----|---------------------|---|----|
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G5 |
| Pr | H | S | G5 |
| F | H | S | G5 |
| Cl | H | S | G5 |
| Cl | 4-Me | S | G5 |
| Cl | 6-Me | S | G5 |
| Cl | 4-Et | S | G5 |
| Cl | 4-OMe | S | G5 |
| Cl | 4-F | S | G5 |
| Cl | 4-Cl | S | G5 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G5 |
| Br | H | S | G5 |
| Br | 4-Me | S | G5 |
| Br | 6-Me | S | G5 |
| Br | 4-Et | S | G5 |
| Br | 4-OMe | S | G5 |
| Br | 4-F | S | G5 |
| Br | 4-Cl | S | G5 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G5 |
| H | H | S | G6 |
| H | 3-Me | S | G6 |
| H | 4-Me | S | G6 |
| H | 5-Me | S | G6 |
| H | 6-Me | S | G6 |
| H | 4-Et | S | G6 |
| H | 4-t-Bu | S | G6 |
| H | 4-i-Pr | S | G6 |
| H | 4-OMe | S | G6 |
| H | 6-OMe | S | G6 |
| H | 3-F | S | G6 |
| H | 4-F | S | G6 |
| H | 5-F | S | G6 |
| H | 6-F | S | G6 |
| H | 4-Cl | S | G6 |
| H | 6-Cl | S | G6 |
| H | 4-Br | S | G6 |
| H | 4,6-Me ₂ | S | G6 |
| Me | H | S | G6 |
| Me | 3-Me | S | G6 |
| Me | 4-Me | S | G6 |
| Me | 5-Me | S | G6 |
| Me | 6-Me | S | G6 |
| Me | 4-Et | S | G6 |
| Me | 4-t-Bu | S | G6 |
| Me | 4-i-Pr | S | G6 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G6 |
| Me | 4-OMe | S | G6 |
| Me | 6-OMe | S | G6 |
| Me | 4-OEt | S | G6 |
| Me | 4-SMe | S | G6 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G6 |
| Me | 3-F | S | G6 |
| Me | 4-F | S | G6 |
| Me | 5-F | S | G6 |
| Me | 6-F | S | G6 |
| Me | 4-Cl | S | G6 |
| Me | 6-Cl | S | G6 |
| Me | 4-Br | S | G6 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| Me | 4-I | S | G6 |
| Me | 4-CN | S | G6 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | S | G6 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | S | G6 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | S | G6 |
| Et | H | S | G6 |
| Et | 4-Me | S | G6 |
| Et | 6-Me | S | G6 |
| Et | 4-Et | S | G6 |
| Et | 4-OMe | S | G6 |
| Et | 4-F | S | G6 |
| Et | 4-Cl | S | G6 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | S | G6 |
| Pr | H | S | G6 |
| F | H | S | G6 |
| Cl | H | S | G6 |
| Cl | 4-Me | S | G6 |
| Cl | 6-Me | S | G6 |
| Cl | 4-Et | S | G6 |
| Cl | 4-OMe | S | G6 |
| Cl | 4-F | S | G6 |
| Cl | 4-Cl | S | G6 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G6 |
| Br | H | S | G6 |
| Br | 4-Me | S | G6 |
| Br | 6-Me | S | G6 |
| Br | 4-Et | S | G6 |
| Br | 4-OMe | S | G6 |
| Br | 4-F | S | G6 |
| Br | 4-Cl | S | G6 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G6 |
| H | H | S | G11 |
| H | 3-Me | S | G11 |
| H | 4-Me | S | G11 |
| H | 5-Me | S | G11 |
| H | 6-Me | S | G11 |
| H | 4-Et | S | G11 |
| H | 4-t-Bu | S | G11 |
| H | 4-i-Pr | S | G11 |
| H | 4-OMe | S | G11 |
| H | 6-OMe | S | G11 |
| H | 3-F | S | G11 |
| H | 4-F | S | G11 |
| H | 5-F | S | G11 |
| H | 6-F | S | G11 |
| H | 4-Cl | S | G11 |
| H | 6-Cl | S | G11 |
| H | 4-Br | S | G11 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G11 |
| Me | H | S | G11 |
| Me | 3-Me | S | G11 |
| Me | 4-Me | S | G11 |
| Me | 5-Me | S | G11 |
| Me | 6-Me | S | G11 |
| Me | 4-Et | S | G11 |
| Me | 4-t-Bu | S | G11 |
| Me | 4-i-Pr | S | G11 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G11 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Me | 4-OMe | S | G11 |
| Me | 6-OMe | S | G11 |
| Me | 4-OEt | S | G11 |
| Me | 4-SMe | S | G11 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G11 |
| Me | 3-F | S | G11 |
| Me | 4-F | S | G11 |
| Me | 5-F | S | G11 |
| Me | 6-F | S | G11 |
| Me | 4-Cl | S | G11 |
| Me | 6-Cl | S | G11 |
| Me | 4-Br | S | G11 |
| Me | 4-I | S | G11 |
| Me | 4-CN | S | G11 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G11 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G11 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G11 |
| Et | H | S | G11 |
| Et | 4-Me | S | G11 |
| Et | 6-Me | S | G11 |
| Et | 4-Et | S | G11 |
| Et | 4-OMe | S | G11 |
| Et | 4-F | S | G11 |
| Et | 4-Cl | S | G11 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G11 |
| Pr | H | S | G11 |
| F | H | S | G11 |
| Cl | H | S | G11 |
| Cl | 4-Me | S | G11 |
| Cl | 6-Me | S | G11 |
| Cl | 4-Et | S | G11 |
| Cl | 4-OMe | S | G11 |
| Cl | 4-F | S | G11 |
| Cl | 4-Cl | S | G11 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G11 |
| Br | H | S | G11 |
| Br | 4-Me | S | G11 |
| Br | 6-Me | S | G11 |
| Br | 4-Et | S | G11 |
| Br | 4-OMe | S | G11 |
| Br | 4-F | S | G11 |
| Br | 4-Cl | S | G11 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G11 |
| H | H | S | G12 |
| H | 3-Me | S | G12 |
| H | 4-Me | S | G12 |
| H | 5-Me | S | G12 |
| H | 6-Me | S | G12 |
| H | 4-Et | S | G12 |
| H | 4-t-Bu | S | G12 |
| H | 4-i-Pr | S | G12 |
| H | 4-OMe | S | G12 |
| H | 6-OMe | S | G12 |
| H | 3-F | S | G12 |
| H | 4-F | S | G12 |
| H | 5-F | S | G12 |
| H | 6-F | S | G12 |
| H | 4-Cl | S | G12 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| H | 6-Cl | S | G12 |
| H | 4-Br | S | G12 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G12 |
| Me | H | S | G12 |
| Me | 3-Me | S | G12 |
| Me | 4-Me | S | G12 |
| Me | 5-Me | S | G12 |
| Me | 6-Me | S | G12 |
| Me | 4-Et | S | G12 |
| Me | 4-t-Bu | S | G12 |
| Me | 4-i-Pr | S | G12 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G12 |
| Me | 4-OMe | S | G12 |
| Me | 6-OMe | S | G12 |
| Me | 4-OEt | S | G12 |
| Me | 4-SMe | S | G12 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G12 |
| Me | 3-F | S | G12 |
| Me | 4-F | S | G12 |
| Me | 5-F | S | G12 |
| Me | 6-F | S | G12 |
| Me | 4-Cl | S | G12 |
| Me | 6-Cl | S | G12 |
| Me | 4-Br | S | G12 |
| Me | 4-I | S | G12 |
| Me | 4-CN | S | G12 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | S | G12 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | S | G12 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | S | G12 |
| Et | H | S | G12 |
| Et | 4-Me | S | G12 |
| Et | 6-Me | S | G12 |
| Et | 4-Et | S | G12 |
| Et | 4-OMe | S | G12 |
| Et | 4-F | S | G12 |
| Et | 4-Cl | S | G12 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | S | G12 |
| Pr | H | S | G12 |
| F | H | S | G12 |
| Cl | H | S | G12 |
| Cl | 4-Me | S | G12 |
| Cl | 6-Me | S | G12 |
| Cl | 4-Et | S | G12 |
| Cl | 4-OMe | S | G12 |
| Cl | 4-F | S | G12 |
| Cl | 4-Cl | S | G12 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G12 |
| Br | H | S | G12 |
| Br | 4-Me | S | G12 |
| Br | 6-Me | S | G12 |
| Br | 4-Et | S | G12 |
| Br | 4-OMe | S | G12 |
| Br | 4-F | S | G12 |
| Br | 4-Cl | S | G12 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G12 |
| H | H | S | G13 |
| H | 3-Me | S | G13 |
| H | 4-Me | S | G13 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| H | 5-Me | S | G13 |
| H | 6-Me | S | G13 |
| H | 4-Et | S | G13 |
| H | 4-t-Bu | S | G13 |
| H | 4-i-Pr | S | G13 |
| H | 4-OMe | S | G13 |
| H | 6-OMe | S | G13 |
| H | 3-F | S | G13 |
| H | 4-F | S | G13 |
| H | 5-F | S | G13 |
| H | 6-F | S | G13 |
| H | 4-Cl | S | G13 |
| H | 6-Cl | S | G13 |
| H | 4-Br | S | G13 |
| H | 4,6-Me ₂ | S | G13 |
| Me | H | S | G13 |
| Me | 3-Me | S | G13 |
| Me | 4-Me | S | G13 |
| Me | 5-Me | S | G13 |
| Me | 6-Me | S | G13 |
| Me | 4-Et | S | G13 |
| Me | 4-t-Bu | S | G13 |
| Me | 4-i-Pr | S | G13 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G13 |
| Me | 4-OMe | S | G13 |
| Me | 6-OMe | S | G13 |
| Me | 4-OEt | S | G13 |
| Me | 4-SMe | S | G13 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G13 |
| Me | 3-F | S | G13 |
| Me | 4-F | S | G13 |
| Me | 5-F | S | G13 |
| Me | 6-F | S | G13 |
| Me | 4-Cl | S | G13 |
| Me | 6-Cl | S | G13 |
| Me | 4-Br | S | G13 |
| Me | 4-I | S | G13 |
| Me | 4-CN | S | G13 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G13 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G13 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G13 |
| Et | H | S | G13 |
| Et | 4-Me | S | G13 |
| Et | 6-Me | S | G13 |
| Et | 4-Et | S | G13 |
| Et | 4-OMe | S | G13 |
| Et | 4-F | S | G13 |
| Et | 4-Cl | S | G13 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G13 |
| Pr | H | S | G13 |
| F | H | S | G13 |
| Cl | H | S | G13 |
| Cl | 4-Me | S | G13 |
| Cl | 6-Me | S | G13 |
| Cl | 4-Et | S | G13 |
| Cl | 4-OMe | S | G13 |
| Cl | 4-F | S | G13 |
| Cl | 4-Cl | S | G13 |

| | | | |
|----|-------------------------|---|-----|
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G13 |
| Br | H | S | G13 |
| Br | 4-Me | S | G13 |
| Br | 6-Me | S | G13 |
| Br | 4-Et | S | G13 |
| Br | 4-OMe | S | G13 |
| Br | 4-F | S | G13 |
| Br | 4-Cl | S | G13 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G13 |
| H | H | S | G14 |
| H | 3-Me | S | G14 |
| H | 4-Me | S | G14 |
| H | 5-Me | S | G14 |
| H | 6-Me | S | G14 |
| H | 4-Et | S | G14 |
| H | 4-t-Bu | S | G14 |
| H | 4-i-Pr | S | G14 |
| H | 4-OMe | S | G14 |
| H | 6-OMe | S | G14 |
| H | 3-F | S | G14 |
| H | 4-F | S | G14 |
| H | 5-F | S | G14 |
| H | 6-F | S | G14 |
| H | 4-Cl | S | G14 |
| H | 6-Cl | S | G14 |
| H | 4-Br | S | G14 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G14 |
| Me | H | S | G14 |
| Me | 3-Me | S | G14 |
| Me | 4-Me | S | G14 |
| Me | 5-Me | S | G14 |
| Me | 6-Me | S | G14 |
| Me | 4-Et | S | G14 |
| Me | 4-t-Bu | S | G14 |
| Me | 4-i-Pr | S | G14 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G14 |
| Me | 4-OMe | S | G14 |
| Me | 6-OMe | S | G14 |
| Me | 4-OEt | S | G14 |
| Me | 4-SMe | S | G14 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G14 |
| Me | 3-F | S | G14 |
| Me | 4-F | S | G14 |
| Me | 5-F | S | G14 |
| Me | 6-F | S | G14 |
| Me | 4-Cl | S | G14 |
| Me | 6-Cl | S | G14 |
| Me | 4-Br | S | G14 |
| Me | 4-I | S | G14 |
| Me | 4-CN | S | G14 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | S | G14 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | S | G14 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | S | G14 |
| Et | H | S | G14 |
| Et | 4-Me | S | G14 |
| Et | 6-Me | S | G14 |
| Et | 4-Et | S | G14 |
| Et | 4-OMe | S | G14 |

| | | | |
|----|----------------------|---|-----|
| Et | 4-F | S | G14 |
| Et | 4-Cl | S | G14 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | S | G14 |
| Pr | H | S | G14 |
| F | H | S | G14 |
| Cl | H | S | G14 |
| Cl | 4-Me | S | G14 |
| Cl | 6-Me | S | G14 |
| Cl | 4-Et | S | G14 |
| Cl | 4-OMe | S | G14 |
| Cl | 4-F | S | G14 |
| Cl | 4-Cl | S | G14 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G14 |
| Br | H | S | G14 |
| Br | 4-Me | S | G14 |
| Br | 6-Me | S | G14 |
| Br | 4-Et | S | G14 |
| Br | 4-OMe | S | G14 |
| Br | 4-F | S | G14 |
| Br | 4-Cl | S | G14 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G14 |
| H | H | S | G15 |
| H | 3-Me | S | G15 |
| H | 4-Me | S | G15 |
| H | 5-Me | S | G15 |
| H | 6-Me | S | G15 |
| H | 4-Et | S | G15 |
| H | 4-t-Bu | S | G15 |
| H | 4-i-Pr | S | G15 |
| H | 4-OMe | S | G15 |
| H | 6-OMe | S | G15 |
| H | 3-F | S | G15 |
| H | 4-F | S | G15 |
| H | 5-F | S | G15 |
| H | 6-F | S | G15 |
| H | 4-Cl | S | G15 |
| H | 6-Cl | S | G15 |
| H | 4-Br | S | G15 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G15 |
| Me | H | S | G15 |
| Me | 3-Me | S | G15 |
| Me | 4-Me | S | G15 |
| Me | 5-Me | S | G15 |
| Me | 6-Me | S | G15 |
| Me | 4-Et | S | G15 |
| Me | 4-t-Bu | S | G15 |
| Me | 4-i-Pr | S | G15 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G15 |
| Me | 4-OMe | S | G15 |
| Me | 6-OMe | S | G15 |
| Me | 4-OEt | S | G15 |
| Me | 4-SMe | S | G15 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G15 |
| Me | 3-F | S | G15 |
| Me | 4-F | S | G15 |
| Me | 5-F | S | G15 |
| Me | 6-F | S | G15 |
| Me | 4-Cl | S | G15 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Me | 6-Cl | S | G15 |
| Me | 4-Br | S | G15 |
| Me | 4-I | S | G15 |
| Me | 4-CN | S | G15 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G15 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G15 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G15 |
| Et | H | S | G15 |
| Et | 4-Me | S | G15 |
| Et | 6-Me | S | G15 |
| Et | 4-Et | S | G15 |
| Et | 4-OMe | S | G15 |
| Et | 4-F | S | G15 |
| Et | 4-Cl | S | G15 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G15 |
| Pr | H | S | G15 |
| F | H | S | G15 |
| Cl | H | S | G15 |
| Cl | 4-Me | S | G15 |
| Cl | 6-Me | S | G15 |
| Cl | 4-Et | S | G15 |
| Cl | 4-OMe | S | G15 |
| Cl | 4-F | S | G15 |
| Cl | 4-Cl | S | G15 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G15 |
| Br | H | S | G15 |
| Br | 4-Me | S | G15 |
| Br | 6-Me | S | G15 |
| Br | 4-Et | S | G15 |
| Br | 4-OMe | S | G15 |
| Br | 4-F | S | G15 |
| Br | 4-Cl | S | G15 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G15 |
| H | H | S | G16 |
| H | 3-Me | S | G16 |
| H | 4-Me | S | G16 |
| H | 5-Me | S | G16 |
| H | 6-Me | S | G16 |
| H | 4-Et | S | G16 |
| H | 4-t-Bu | S | G16 |
| H | 4-i-Pr | S | G16 |
| H | 4-OMe | S | G16 |
| H | 6-OMe | S | G16 |
| H | 3-F | S | G16 |
| H | 4-F | S | G16 |
| H | 5-F | S | G16 |
| H | 6-F | S | G16 |
| H | 4-Cl | S | G16 |
| H | 6-Cl | S | G16 |
| H | 4-Br | S | G16 |
| H | 4,6-Me ₂ | S | G16 |
| Me | H | S | G16 |
| Me | 3-Me | S | G16 |
| Me | 4-Me | S | G16 |
| Me | 5-Me | S | G16 |
| Me | 6-Me | S | G16 |
| Me | 4-Et | S | G16 |
| Me | 4-t-Bu | S | G16 |

| | | | |
|----|------------------------|---|-----|
| Me | 4-i-Pr | S | G16 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G16 |
| Me | 4-OMe | S | G16 |
| Me | 6-OMe | S | G16 |
| Me | 4-OEt | S | G16 |
| Me | 4-SMe | S | G16 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G16 |
| Me | 3-F | S | G16 |
| Me | 4-F | S | G16 |
| Me | 5-F | S | G16 |
| Me | 6-F | S | G16 |
| Me | 4-Cl | S | G16 |
| Me | 6-Cl | S | G16 |
| Me | 4-Br | S | G16 |
| Me | 4-I | S | G16 |
| Me | 4-CN | S | G16 |
| Me | 4,5-Me ₂ | S | G16 |
| Me | 4,6-Me ₂ | S | G16 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | S | G16 |
| Et | H | S | G16 |
| Et | 4-Me | S | G16 |
| Et | 6-Me | S | G16 |
| Et | 4-Et | S | G16 |
| Et | 4-OMe | S | G16 |
| Et | 4-F | S | G16 |
| Et | 4-Cl | S | G16 |
| Et | 4,6-Me ₂ | S | G16 |
| Pr | H | S | G16 |
| F | H | S | G16 |
| Cl | H | S | G16 |
| Cl | 4-Me | S | G16 |
| Cl | 6-Me | S | G16 |
| Cl | 4-Et | S | G16 |
| Cl | 4-OMe | S | G16 |
| Cl | 4-F | S | G16 |
| Cl | 4-Cl | S | G16 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | S | G16 |
| Br | H | S | G16 |
| Br | 4-Me | S | G16 |
| Br | 6-Me | S | G16 |
| Br | 4-Et | S | G16 |
| Br | 4-OMe | S | G16 |
| Br | 4-F | S | G16 |
| Br | 4-Cl | S | G16 |
| Br | 4,6-Me ₂ | S | G16 |
| H | H | S | G17 |
| H | 3-Me | S | G17 |
| H | 4-Me | S | G17 |
| H | 5-Me | S | G17 |
| H | 6-Me | S | G17 |
| H | 4-Et | S | G17 |
| H | 4-t-Bu | S | G17 |
| H | 4-i-Pr | S | G17 |
| H | 4-OMe | S | G17 |
| H | 6-OMe | S | G17 |
| H | 3-F | S | G17 |
| H | 4-F | S | G17 |
| H | 5-F | S | G17 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| H | 6-F | S | G17 |
| H | 4-Cl | S | G17 |
| H | 6-Cl | S | G17 |
| H | 4-Br | S | G17 |
| H | 4, 6-Me ₂ | S | G17 |
| Me | H | S | G17 |
| Me | 3-Me | S | G17 |
| Me | 4-Me | S | G17 |
| Me | 5-Me | S | G17 |
| Me | 6-Me | S | G17 |
| Me | 4-Et | S | G17 |
| Me | 4-t-Bu | S | G17 |
| Me | 4-i-Pr | S | G17 |
| Me | 4-CF ₃ | S | G17 |
| Me | 4-OMe | S | G17 |
| Me | 6-OMe | S | G17 |
| Me | 4-OEt | S | G17 |
| Me | 4-SMe | S | G17 |
| Me | 4-NMe ₂ | S | G17 |
| Me | 3-F | S | G17 |
| Me | 4-F | S | G17 |
| Me | 5-F | S | G17 |
| Me | 6-F | S | G17 |
| Me | 4-Cl | S | G17 |
| Me | 6-Cl | S | G17 |
| Me | 4-Br | S | G17 |
| Me | 4-I | S | G17 |
| Me | 4-CN | S | G17 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | S | G17 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | S | G17 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | S | G17 |
| Et | H | S | G17 |
| Et | 4-Me | S | G17 |
| Et | 6-Me | S | G17 |
| Et | 4-Et | S | G17 |
| Et | 4-OMe | S | G17 |
| Et | 4-F | S | G17 |
| Et | 4-Cl | S | G17 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | S | G17 |
| Pr | H | S | G17 |
| F | H | S | G17 |
| Cl | H | S | G17 |
| Cl | 4-Me | S | G17 |
| Cl | 6-Me | S | G17 |
| Cl | 4-Et | S | G17 |
| Cl | 4-OMe | S | G17 |
| Cl | 4-F | S | G17 |
| Cl | 4-Cl | S | G17 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | S | G17 |
| Br | H | S | G17 |
| Br | 4-Me | S | G17 |
| Br | 6-Me | S | G17 |
| Br | 4-Et | S | G17 |
| Br | 4-OMe | S | G17 |
| Br | 4-F | S | G17 |
| Br | 4-Cl | S | G17 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | S | G17 |
| H | H | N-Me | G1 |

| | | | |
|----|------------------------|------|----|
| H | 3-Me | N-Me | G1 |
| H | 4-Me | N-Me | G1 |
| H | 5-Me | N-Me | G1 |
| H | 6-Me | N-Me | G1 |
| H | 4-Et | N-Me | G1 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G1 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G1 |
| H | 4-OMe | N-Me | G1 |
| H | 6-OMe | N-Me | G1 |
| H | 3-F | N-Me | G1 |
| H | 4-F | N-Me | G1 |
| H | 5-F | N-Me | G1 |
| H | 6-F | N-Me | G1 |
| H | 4-Cl | N-Me | G1 |
| H | 6-Cl | N-Me | G1 |
| H | 4-Br | N-Me | G1 |
| H | 4,6-Me ₂ | N-Me | G1 |
| Me | H | N-Me | G1 |
| Me | 3-Me | N-Me | G1 |
| Me | 4-Me | N-Me | G1 |
| Me | 5-Me | N-Me | G1 |
| Me | 6-Me | N-Me | G1 |
| Me | 4-Et | N-Me | G1 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G1 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G1 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G1 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G1 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G1 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G1 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G1 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G1 |
| Me | 3-F | N-Me | G1 |
| Me | 4-F | N-Me | G1 |
| Me | 5-F | N-Me | G1 |
| Me | 6-F | N-Me | G1 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G1 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G1 |
| Me | 4-Br | N-Me | G1 |
| Me | 4-I | N-Me | G1 |
| Me | 4-CN | N-Me | G1 |
| Me | 4,5-Me ₂ | N-Me | G1 |
| Me | 4,6-Me ₂ | N-Me | G1 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | N-Me | G1 |
| Et | H | N-Me | G1 |
| Et | 4-Me | N-Me | G1 |
| Et | 6-Me | N-Me | G1 |
| Et | 4-Et | N-Me | G1 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G1 |
| Et | 4-F | N-Me | G1 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G1 |
| Et | 4,6-Me ₂ | N-Me | G1 |
| Pr | H | N-Me | G1 |
| F | H | N-Me | G1 |
| Cl | H | N-Me | G1 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G1 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G1 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G1 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G1 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|----|
| Cl | 4-F | N-Me | G1 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G1 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G1 |
| Br | H | N-Me | G1 |
| Br | 4-Me | N-Me | G1 |
| Br | 6-Me | N-Me | G1 |
| Br | 4-Et | N-Me | G1 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G1 |
| Br | 4-F | N-Me | G1 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G1 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G1 |
| H | H | N-Me | G2 |
| H | 3-Me | N-Me | G2 |
| H | 4-Me | N-Me | G2 |
| H | 5-Me | N-Me | G2 |
| H | 6-Me | N-Me | G2 |
| H | 4-Et | N-Me | G2 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G2 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G2 |
| H | 4-OMe | N-Me | G2 |
| H | 6-OMe | N-Me | G2 |
| H | 3-F | N-Me | G2 |
| H | 4-F | N-Me | G2 |
| H | 5-F | N-Me | G2 |
| H | 6-F | N-Me | G2 |
| H | 4-Cl | N-Me | G2 |
| H | 6-Cl | N-Me | G2 |
| H | 4-Br | N-Me | G2 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G2 |
| Me | H | N-Me | G2 |
| Me | 3-Me | N-Me | G2 |
| Me | 4-Me | N-Me | G2 |
| Me | 5-Me | N-Me | G2 |
| Me | 6-Me | N-Me | G2 |
| Me | 4-Et | N-Me | G2 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G2 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G2 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G2 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G2 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G2 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G2 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G2 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G2 |
| Me | 3-F | N-Me | G2 |
| Me | 4-F | N-Me | G2 |
| Me | 5-F | N-Me | G2 |
| Me | 6-F | N-Me | G2 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G2 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G2 |
| Me | 4-Br | N-Me | G2 |
| Me | 4-I | N-Me | G2 |
| Me | 4-CN | N-Me | G2 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G2 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G2 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G2 |
| Et | H | N-Me | G2 |
| Et | 4-Me | N-Me | G2 |
| Et | 6-Me | N-Me | G2 |

| | | | |
|----|---------------------|------|----|
| Et | 4-Et | N-Me | G2 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G2 |
| Et | 4-F | N-Me | G2 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G2 |
| Et | 4,6-Me ₂ | N-Me | G2 |
| Pr | H | N-Me | G2 |
| F | H | N-Me | G2 |
| Cl | H | N-Me | G2 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G2 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G2 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G2 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G2 |
| Cl | 4-F | N-Me | G2 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G2 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | N-Me | G2 |
| Br | H | N-Me | G2 |
| Br | 4-Me | N-Me | G2 |
| Br | 6-Me | N-Me | G2 |
| Br | 4-Et | N-Me | G2 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G2 |
| Br | 4-F | N-Me | G2 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G2 |
| Br | 4,6-Me ₂ | N-Me | G2 |
| H | H | N-Me | G4 |
| H | 3-Me | N-Me | G4 |
| H | 4-Me | N-Me | G4 |
| H | 5-Me | N-Me | G4 |
| H | 6-Me | N-Me | G4 |
| H | 4-Et | N-Me | G4 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G4 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G4 |
| H | 4-OMe | N-Me | G4 |
| H | 6-OMe | N-Me | G4 |
| H | 3-F | N-Me | G4 |
| H | 4-F | N-Me | G4 |
| H | 5-F | N-Me | G4 |
| H | 6-F | N-Me | G4 |
| H | 4-Cl | N-Me | G4 |
| H | 6-Cl | N-Me | G4 |
| H | 4-Br | N-Me | G4 |
| H | 4,6-Me ₂ | N-Me | G4 |
| Me | H | N-Me | G4 |
| Me | 3-Me | N-Me | G4 |
| Me | 4-Me | N-Me | G4 |
| Me | 5-Me | N-Me | G4 |
| Me | 6-Me | N-Me | G4 |
| Me | 4-Et | N-Me | G4 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G4 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G4 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G4 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G4 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G4 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G4 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G4 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G4 |
| Me | 3-F | N-Me | G4 |
| Me | 4-F | N-Me | G4 |
| Me | 5-F | N-Me | G4 |

| | | | |
|----|------------------------|------|----|
| Me | 6-F | N-Me | G4 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G4 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G4 |
| Me | 4-Br | N-Me | G4 |
| Me | 4-I | N-Me | G4 |
| Me | 4-CN | N-Me | G4 |
| Me | 4,5-Me ₂ | N-Me | G4 |
| Me | 4,6-Me ₂ | N-Me | G4 |
| Me | 4,5-(OMe) ₂ | N-Me | G4 |
| Et | H | N-Me | G4 |
| Et | 4-Me | N-Me | G4 |
| Et | 6-Me | N-Me | G4 |
| Et | 4-Et | N-Me | G4 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G4 |
| Et | 4-F | N-Me | G4 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G4 |
| Et | 4,6-Me ₂ | N-Me | G4 |
| Pr | H | N-Me | G4 |
| F | H | N-Me | G4 |
| Cl | H | N-Me | G4 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G4 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G4 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G4 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G4 |
| Cl | 4-F | N-Me | G4 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G4 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | N-Me | G4 |
| Br | H | N-Me | G4 |
| Br | 4-Me | N-Me | G4 |
| Br | 6-Me | N-Me | G4 |
| Br | 4-Et | N-Me | G4 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G4 |
| Br | 4-F | N-Me | G4 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G4 |
| Br | 4,6-Me ₂ | N-Me | G4 |
| H | H | N-Me | G5 |
| H | 3-Me | N-Me | G5 |
| H | 4-Me | N-Me | G5 |
| H | 5-Me | N-Me | G5 |
| H | 6-Me | N-Me | G5 |
| H | 4-Et | N-Me | G5 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G5 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G5 |
| H | 4-OMe | N-Me | G5 |
| H | 6-OMe | N-Me | G5 |
| H | 3-F | N-Me | G5 |
| H | 4-F | N-Me | G5 |
| H | 5-F | N-Me | G5 |
| H | 6-F | N-Me | G5 |
| H | 4-Cl | N-Me | G5 |
| H | 6-Cl | N-Me | G5 |
| H | 4-Br | N-Me | G5 |
| H | 4,6-Me ₂ | N-Me | G5 |
| Me | H | N-Me | G5 |
| Me | 3-Me | N-Me | G5 |
| Me | 4-Me | N-Me | G5 |
| Me | 5-Me | N-Me | G5 |
| Me | 6-Me | N-Me | G5 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|----|
| Me | 4-Et | N-Me | G5 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G5 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G5 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G5 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G5 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G5 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G5 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G5 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G5 |
| Me | 3-F | N-Me | G5 |
| Me | 4-F | N-Me | G5 |
| Me | 5-F | N-Me | G5 |
| Me | 6-F | N-Me | G5 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G5 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G5 |
| Me | 4-Br | N-Me | G5 |
| Me | 4-I | N-Me | G5 |
| Me | 4-CN | N-Me | G5 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G5 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G5 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G5 |
| Et | H | N-Me | G5 |
| Et | 4-Me | N-Me | G5 |
| Et | 6-Me | N-Me | G5 |
| Et | 4-Et | N-Me | G5 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G5 |
| Et | 4-F | N-Me | G5 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G5 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G5 |
| Pr | H | N-Me | G5 |
| F | H | N-Me | G5 |
| Cl | H | N-Me | G5 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G5 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G5 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G5 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G5 |
| Cl | 4-F | N-Me | G5 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G5 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G5 |
| Br | H | N-Me | G5 |
| Br | 4-Me | N-Me | G5 |
| Br | 6-Me | N-Me | G5 |
| Br | 4-Et | N-Me | G5 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G5 |
| Br | 4-F | N-Me | G5 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G5 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G5 |
| H | H | N-Me | G6 |
| H | 3-Me | N-Me | G6 |
| H | 4-Me | N-Me | G6 |
| H | 5-Me | N-Me | G6 |
| H | 6-Me | N-Me | G6 |
| H | 4-Et | N-Me | G6 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G6 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G6 |
| H | 4-OMe | N-Me | G6 |
| H | 6-OMe | N-Me | G6 |
| H | 3-F | N-Me | G6 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|----|
| H | 4-F | N-Me | G6 |
| H | 5-F | N-Me | G6 |
| H | 6-F | N-Me | G6 |
| H | 4-Cl | N-Me | G6 |
| H | 6-Cl | N-Me | G6 |
| H | 4-Br | N-Me | G6 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G6 |
| Me | H | N-Me | G6 |
| Me | 3-Me | N-Me | G6 |
| Me | 4-Me | N-Me | G6 |
| Me | 5-Me | N-Me | G6 |
| Me | 6-Me | N-Me | G6 |
| Me | 4-Et | N-Me | G6 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G6 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G6 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G6 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G6 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G6 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G6 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G6 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G6 |
| Me | 3-F | N-Me | G6 |
| Me | 4-F | N-Me | G6 |
| Me | 5-F | N-Me | G6 |
| Me | 6-F | N-Me | G6 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G6 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G6 |
| Me | 4-Br | N-Me | G6 |
| Me | 4-I | N-Me | G6 |
| Me | 4-CN | N-Me | G6 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G6 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G6 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G6 |
| Et | H | N-Me | G6 |
| Et | 4-Me | N-Me | G6 |
| Et | 6-Me | N-Me | G6 |
| Et | 4-Et | N-Me | G6 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G6 |
| Et | 4-F | N-Me | G6 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G6 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G6 |
| Pr | H | N-Me | G6 |
| F | H | N-Me | G6 |
| Cl | H | N-Me | G6 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G6 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G6 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G6 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G6 |
| Cl | 4-F | N-Me | G6 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G6 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G6 |
| Br | H | N-Me | G6 |
| Br | 4-Me | N-Me | G6 |
| Br | 6-Me | N-Me | G6 |
| Br | 4-Et | N-Me | G6 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G6 |
| Br | 4-F | N-Me | G6 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G6 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G6 |
| H | H | N-Me | G11 |
| H | 3-Me | N-Me | G11 |
| H | 4-Me | N-Me | G11 |
| H | 5-Me | N-Me | G11 |
| H | 6-Me | N-Me | G11 |
| H | 4-Et | N-Me | G11 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G11 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G11 |
| H | 4-OMe | N-Me | G11 |
| H | 6-OMe | N-Me | G11 |
| H | 3-F | N-Me | G11 |
| H | 4-F | N-Me | G11 |
| H | 5-F | N-Me | G11 |
| H | 6-F | N-Me | G11 |
| H | 4-Cl | N-Me | G11 |
| H | 6-Cl | N-Me | G11 |
| H | 4-Br | N-Me | G11 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G11 |
| Me | H | N-Me | G11 |
| Me | 3-Me | N-Me | G11 |
| Me | 4-Me | N-Me | G11 |
| Me | 5-Me | N-Me | G11 |
| Me | 6-Me | N-Me | G11 |
| Me | 4-Et | N-Me | G11 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G11 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G11 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G11 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G11 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G11 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G11 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G11 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G11 |
| Me | 3-F | N-Me | G11 |
| Me | 4-F | N-Me | G11 |
| Me | 5-F | N-Me | G11 |
| Me | 6-F | N-Me | G11 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G11 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G11 |
| Me | 4-Br | N-Me | G11 |
| Me | 4-I | N-Me | G11 |
| Me | 4-CN | N-Me | G11 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G11 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G11 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G11 |
| Et | H | N-Me | G11 |
| Et | 4-Me | N-Me | G11 |
| Et | 6-Me | N-Me | G11 |
| Et | 4-Et | N-Me | G11 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G11 |
| Et | 4-F | N-Me | G11 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G11 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G11 |
| Pr | H | N-Me | G11 |
| F | H | N-Me | G11 |
| Cl | H | N-Me | G11 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G11 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G11 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Cl | 4-Et | N-Me | G11 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G11 |
| Cl | 4-F | N-Me | G11 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G11 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G11 |
| Br | H | N-Me | G11 |
| Br | 4-Me | N-Me | G11 |
| Br | 6-Me | N-Me | G11 |
| Br | 4-Et | N-Me | G11 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G11 |
| Br | 4-F | N-Me | G11 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G11 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G11 |
| H | H | N-Me | G12 |
| H | 3-Me | N-Me | G12 |
| H | 4-Me | N-Me | G12 |
| H | 5-Me | N-Me | G12 |
| H | 6-Me | N-Me | G12 |
| H | 4-Et | N-Me | G12 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G12 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G12 |
| H | 4-OMe | N-Me | G12 |
| H | 6-OMe | N-Me | G12 |
| H | 3-F | N-Me | G12 |
| H | 4-F | N-Me | G12 |
| H | 5-F | N-Me | G12 |
| H | 6-F | N-Me | G12 |
| H | 4-Cl | N-Me | G12 |
| H | 6-Cl | N-Me | G12 |
| H | 4-Br | N-Me | G12 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G12 |
| Me | H | N-Me | G12 |
| Me | 3-Me | N-Me | G12 |
| Me | 4-Me | N-Me | G12 |
| Me | 5-Me | N-Me | G12 |
| Me | 6-Me | N-Me | G12 |
| Me | 4-Et | N-Me | G12 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G12 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G12 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G12 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G12 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G12 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G12 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G12 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G12 |
| Me | 3-F | N-Me | G12 |
| Me | 4-F | N-Me | G12 |
| Me | 5-F | N-Me | G12 |
| Me | 6-F | N-Me | G12 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G12 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G12 |
| Me | 4-Br | N-Me | G12 |
| Me | 4-I | N-Me | G12 |
| Me | 4-CN | N-Me | G12 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G12 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G12 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G12 |
| Et | H | N-Me | G12 |

| | | | |
|----|----------------------|------|-----|
| Et | 4-Me | N-Me | G12 |
| Et | 6-Me | N-Me | G12 |
| Et | 4-Et | N-Me | G12 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G12 |
| Et | 4-F | N-Me | G12 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G12 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G12 |
| Pr | H | N-Me | G12 |
| F | H | N-Me | G12 |
| Cl | H | N-Me | G12 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G12 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G12 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G12 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G12 |
| Cl | 4-F | N-Me | G12 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G12 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G12 |
| Br | H | N-Me | G12 |
| Br | 4-Me | N-Me | G12 |
| Br | 6-Me | N-Me | G12 |
| Br | 4-Et | N-Me | G12 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G12 |
| Br | 4-F | N-Me | G12 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G12 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G12 |
| H | H | N-Me | G13 |
| H | 3-Me | N-Me | G13 |
| H | 4-Me | N-Me | G13 |
| H | 5-Me | N-Me | G13 |
| H | 6-Me | N-Me | G13 |
| H | 4-Et | N-Me | G13 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G13 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G13 |
| H | 4-OMe | N-Me | G13 |
| H | 6-OMe | N-Me | G13 |
| H | 3-F | N-Me | G13 |
| H | 4-F | N-Me | G13 |
| H | 5-F | N-Me | G13 |
| H | 6-F | N-Me | G13 |
| H | 4-Cl | N-Me | G13 |
| H | 6-Cl | N-Me | G13 |
| H | 4-Br | N-Me | G13 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G13 |
| Me | H | N-Me | G13 |
| Me | 3-Me | N-Me | G13 |
| Me | 4-Me | N-Me | G13 |
| Me | 5-Me | N-Me | G13 |
| Me | 6-Me | N-Me | G13 |
| Me | 4-Et | N-Me | G13 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G13 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G13 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G13 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G13 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G13 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G13 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G13 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G13 |
| Me | 3-F | N-Me | G13 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Me | 4-F | N-Me | G13 |
| Me | 5-F | N-Me | G13 |
| Me | 6-F | N-Me | G13 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G13 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G13 |
| Me | 4-Br | N-Me | G13 |
| Me | 4-I | N-Me | G13 |
| Me | 4-CN | N-Me | G13 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G13 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G13 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G13 |
| Et | H | N-Me | G13 |
| Et | 4-Me | N-Me | G13 |
| Et | 6-Me | N-Me | G13 |
| Et | 4-Et | N-Me | G13 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G13 |
| Et | 4-F | N-Me | G13 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G13 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G13 |
| Pr | H | N-Me | G13 |
| F | H | N-Me | G13 |
| Cl | H | N-Me | G13 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G13 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G13 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G13 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G13 |
| Cl | 4-F | N-Me | G13 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G13 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G13 |
| Br | H | N-Me | G13 |
| Br | 4-Me | N-Me | G13 |
| Br | 6-Me | N-Me | G13 |
| Br | 4-Et | N-Me | G13 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G13 |
| Br | 4-F | N-Me | G13 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G13 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G13 |
| H | H | N-Me | G14 |
| H | 3-Me | N-Me | G14 |
| H | 4-Me | N-Me | G14 |
| H | 5-Me | N-Me | G14 |
| H | 6-Me | N-Me | G14 |
| H | 4-Et | N-Me | G14 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G14 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G14 |
| H | 4-OMe | N-Me | G14 |
| H | 6-OMe | N-Me | G14 |
| H | 3-F | N-Me | G14 |
| H | 4-F | N-Me | G14 |
| H | 5-F | N-Me | G14 |
| H | 6-F | N-Me | G14 |
| H | 4-Cl | N-Me | G14 |
| H | 6-Cl | N-Me | G14 |
| H | 4-Br | N-Me | G14 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G14 |
| Me | H | N-Me | G14 |
| Me | 3-Me | N-Me | G14 |
| Me | 4-Me | N-Me | G14 |

| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Me | 5-Me | N-Me | G14 |
| Me | 6-Me | N-Me | G14 |
| Me | 4-Et | N-Me | G14 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G14 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G14 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G14 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G14 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G14 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G14 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G14 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G14 |
| Me | 3-F | N-Me | G14 |
| Me | 4-F | N-Me | G14 |
| Me | 5-F | N-Me | G14 |
| Me | 6-F | N-Me | G14 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G14 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G14 |
| Me | 4-Br | N-Me | G14 |
| Me | 4-I | N-Me | G14 |
| Me | 4-CN | N-Me | G14 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G14 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G14 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G14 |
| Et | H | N-Me | G14 |
| Et | 4-Me | N-Me | G14 |
| Et | 6-Me | N-Me | G14 |
| Et | 4-Et | N-Me | G14 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G14 |
| Et | 4-F | N-Me | G14 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G14 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G14 |
| Pr | H | N-Me | G14 |
| F | H | N-Me | G14 |
| Cl | H | N-Me | G14 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G14 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G14 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G14 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G14 |
| Cl | 4-F | N-Me | G14 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G14 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G14 |
| Br | H | N-Me | G14 |
| Br | 4-Me | N-Me | G14 |
| Br | 6-Me | N-Me | G14 |
| Br | 4-Et | N-Me | G14 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G14 |
| Br | 4-F | N-Me | G14 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G14 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G14 |
| H | H | N-Me | G15 |
| H | 3-Me | N-Me | G15 |
| H | 4-Me | N-Me | G15 |
| H | 5-Me | N-Me | G15 |
| H | 6-Me | N-Me | G15 |
| H | 4-Et | N-Me | G15 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G15 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G15 |
| H | 4-OMe | N-Me | G15 |

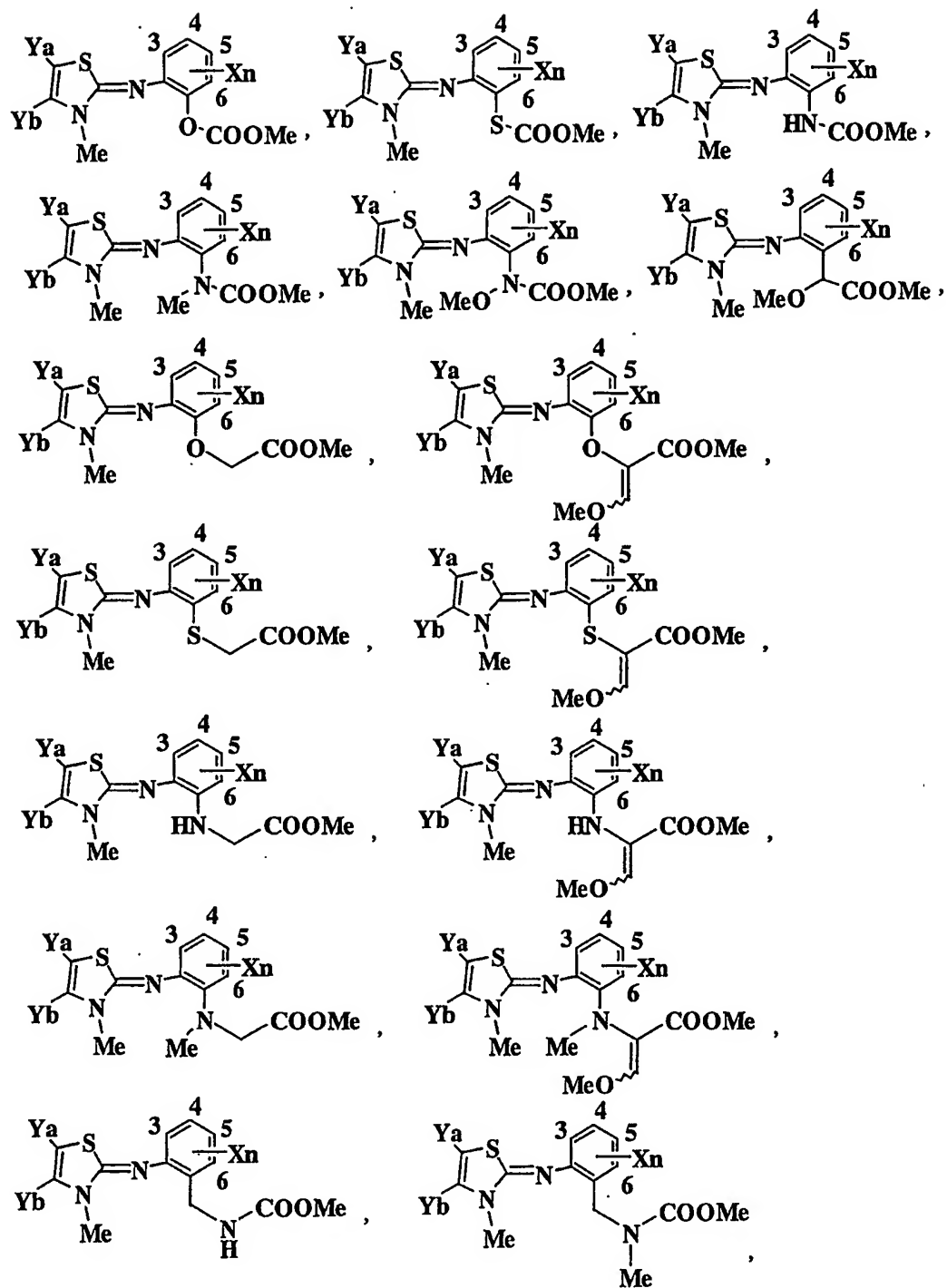
| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| H | 6-OMe | N-Me | G15 |
| H | 3-F | N-Me | G15 |
| H | 4-F | N-Me | G15 |
| H | 5-F | N-Me | G15 |
| H | 6-F | N-Me | G15 |
| H | 4-Cl | N-Me | G15 |
| H | 6-Cl | N-Me | G15 |
| H | 4-Br | N-Me | G15 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G15 |
| Me | H | N-Me | G15 |
| Me | 3-Me | N-Me | G15 |
| Me | 4-Me | N-Me | G15 |
| Me | 5-Me | N-Me | G15 |
| Me | 6-Me | N-Me | G15 |
| Me | 4-Et | N-Me | G15 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G15 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G15 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G15 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G15 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G15 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G15 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G15 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G15 |
| Me | 3-F | N-Me | G15 |
| Me | 4-F | N-Me | G15 |
| Me | 5-F | N-Me | G15 |
| Me | 6-F | N-Me | G15 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G15 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G15 |
| Me | 4-Br | N-Me | G15 |
| Me | 4-I | N-Me | G15 |
| Me | 4-CN | N-Me | G15 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G15 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G15 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G15 |
| Et | H | N-Me | G15 |
| Et | 4-Me | N-Me | G15 |
| Et | 6-Me | N-Me | G15 |
| Et | 4-Et | N-Me | G15 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G15 |
| Et | 4-F | N-Me | G15 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G15 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G15 |
| Pr | H | N-Me | G15 |
| F | H | N-Me | G15 |
| Cl | H | N-Me | G15 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G15 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G15 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G15 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G15 |
| Cl | 4-F | N-Me | G15 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G15 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G15 |
| Br | H | N-Me | G15 |
| Br | 4-Me | N-Me | G15 |
| Br | 6-Me | N-Me | G15 |
| Br | 4-Et | N-Me | G15 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G15 |

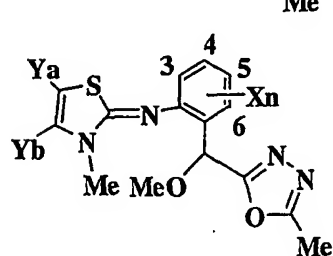
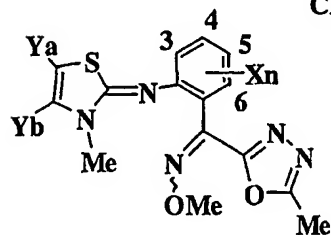
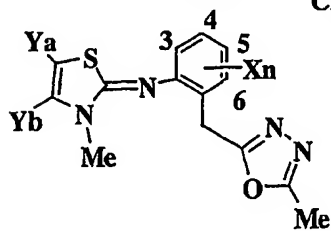
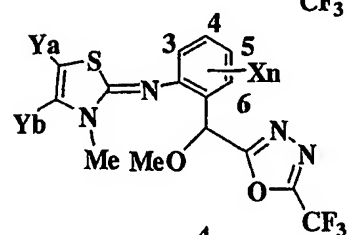
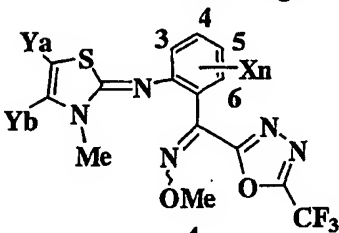
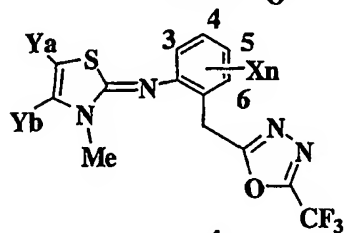
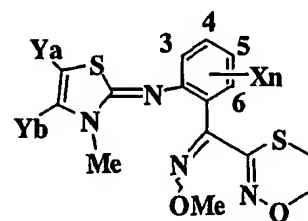
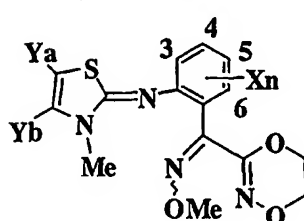
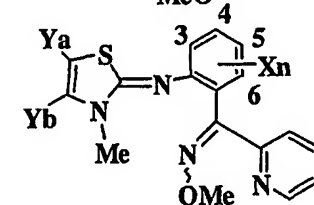
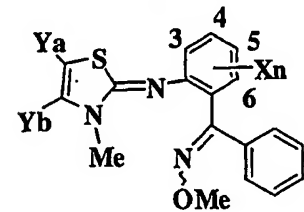
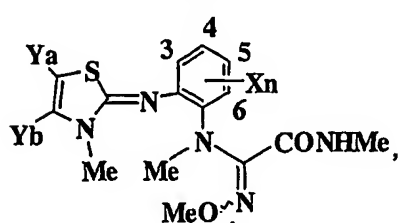
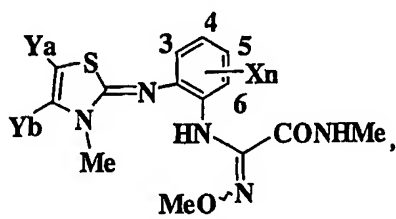
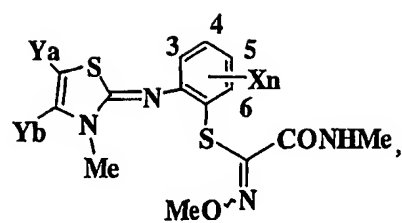
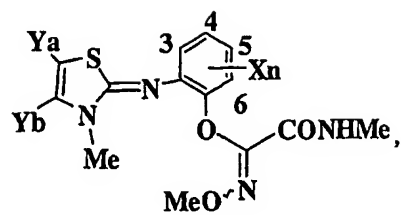
| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Br | 4-F | N-Me | G15 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G15 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G15 |
| H | H | N-Me | G16 |
| H | 3-Me | N-Me | G16 |
| H | 4-Me | N-Me | G16 |
| H | 5-Me | N-Me | G16 |
| H | 6-Me | N-Me | G16 |
| H | 4-Et | N-Me | G16 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G16 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G16 |
| H | 4-OMe | N-Me | G16 |
| H | 6-OMe | N-Me | G16 |
| H | 3-F | N-Me | G16 |
| H | 4-F | N-Me | G16 |
| H | 5-F | N-Me | G16 |
| H | 6-F | N-Me | G16 |
| H | 4-Cl | N-Me | G16 |
| H | 6-Cl | N-Me | G16 |
| H | 4-Br | N-Me | G16 |
| H | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G16 |
| Me | H | N-Me | G16 |
| Me | 3-Me | N-Me | G16 |
| Me | 4-Me | N-Me | G16 |
| Me | 5-Me | N-Me | G16 |
| Me | 6-Me | N-Me | G16 |
| Me | 4-Et | N-Me | G16 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G16 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G16 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G16 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G16 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G16 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G16 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G16 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G16 |
| Me | 3-F | N-Me | G16 |
| Me | 4-F | N-Me | G16 |
| Me | 5-F | N-Me | G16 |
| Me | 6-F | N-Me | G16 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G16 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G16 |
| Me | 4-Br | N-Me | G16 |
| Me | 4-I | N-Me | G16 |
| Me | 4-CN | N-Me | G16 |
| Me | 4, 5-Me ₂ | N-Me | G16 |
| Me | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G16 |
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G16 |
| Et | H | N-Me | G16 |
| Et | 4-Me | N-Me | G16 |
| Et | 6-Me | N-Me | G16 |
| Et | 4-Et | N-Me | G16 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G16 |
| Et | 4-F | N-Me | G16 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G16 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G16 |
| Pr | H | N-Me | G16 |
| F | H | N-Me | G16 |
| Cl | H | N-Me | G16 |

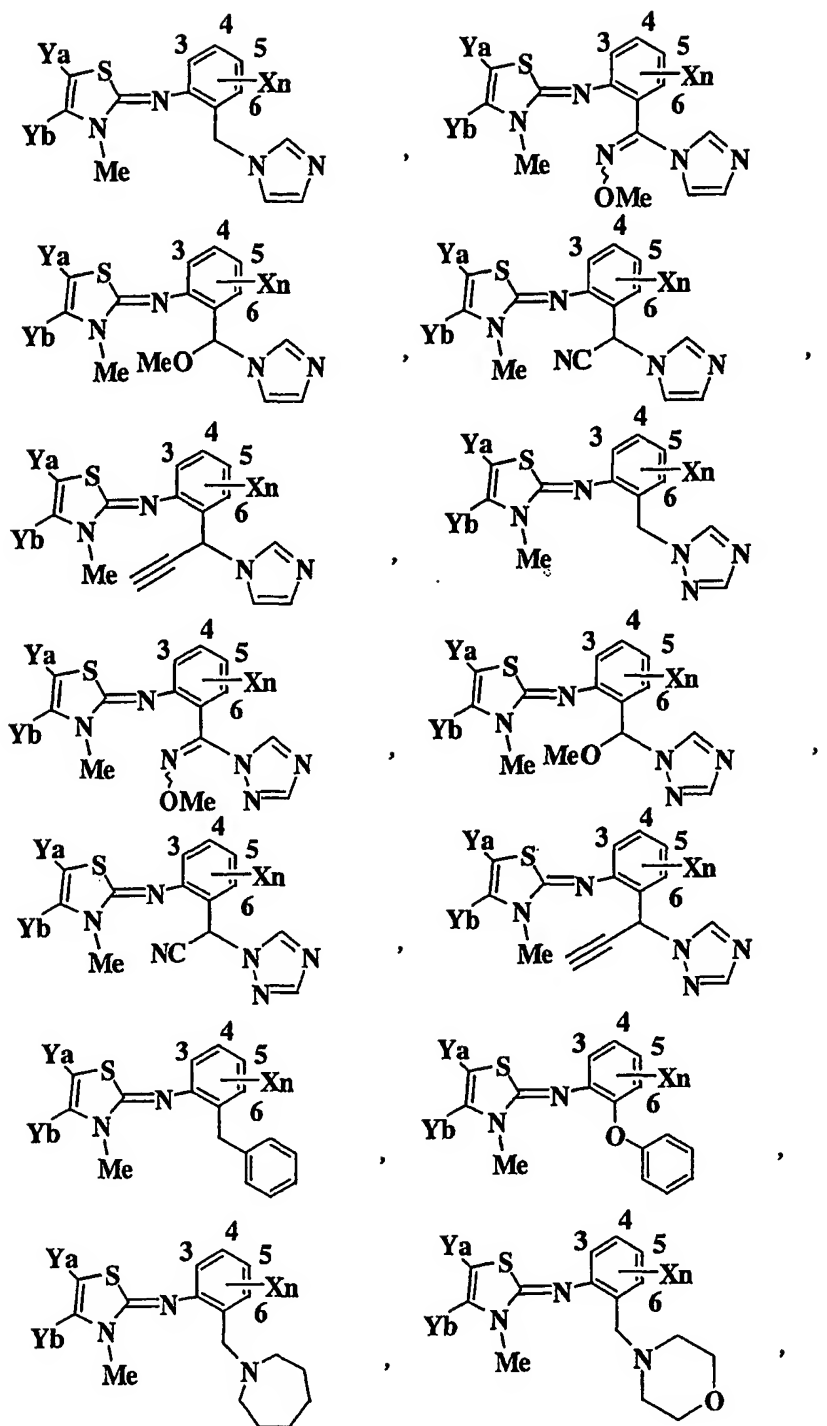
| | | | |
|----|---------------------|------|-----|
| Cl | 4-Me | N-Me | G16 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G16 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G16 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G16 |
| Cl | 4-F | N-Me | G16 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G16 |
| Cl | 4,6-Me ₂ | N-Me | G16 |
| Br | H | N-Me | G16 |
| Br | 4-Me | N-Me | G16 |
| Br | 6-Me | N-Me | G16 |
| Br | 4-Et | N-Me | G16 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G16 |
| Br | 4-F | N-Me | G16 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G16 |
| Br | 4,6-Me ₂ | N-Me | G16 |
| H | H | N-Me | G17 |
| H | 3-Me | N-Me | G17 |
| H | 4-Me | N-Me | G17 |
| H | 5-Me | N-Me | G17 |
| H | 6-Me | N-Me | G17 |
| H | 4-Et | N-Me | G17 |
| H | 4-t-Bu | N-Me | G17 |
| H | 4-i-Pr | N-Me | G17 |
| H | 4-OMe | N-Me | G17 |
| H | 6-OMe | N-Me | G17 |
| H | 3-F | N-Me | G17 |
| H | 4-F | N-Me | G17 |
| H | 5-F | N-Me | G17 |
| H | 6-F | N-Me | G17 |
| H | 4-Cl | N-Me | G17 |
| H | 6-Cl | N-Me | G17 |
| H | 4-Br | N-Me | G17 |
| H | 4,6-Me ₂ | N-Me | G17 |
| Me | H | N-Me | G17 |
| Me | 3-Me | N-Me | G17 |
| Me | 4-Me | N-Me | G17 |
| Me | 5-Me | N-Me | G17 |
| Me | 6-Me | N-Me | G17 |
| Me | 4-Et | N-Me | G17 |
| Me | 4-t-Bu | N-Me | G17 |
| Me | 4-i-Pr | N-Me | G17 |
| Me | 4-CF ₃ | N-Me | G17 |
| Me | 4-OMe | N-Me | G17 |
| Me | 6-OMe | N-Me | G17 |
| Me | 4-OEt | N-Me | G17 |
| Me | 4-SMe | N-Me | G17 |
| Me | 4-NMe ₂ | N-Me | G17 |
| Me | 3-F | N-Me | G17 |
| Me | 4-F | N-Me | G17 |
| Me | 5-F | N-Me | G17 |
| Me | 6-F | N-Me | G17 |
| Me | 4-Cl | N-Me | G17 |
| Me | 6-Cl | N-Me | G17 |
| Me | 4-Br | N-Me | G17 |
| Me | 4-I | N-Me | G17 |
| Me | 4-CN | N-Me | G17 |
| Me | 4,5-Me ₂ | N-Me | G17 |
| Me | 4,6-Me ₂ | N-Me | G17 |

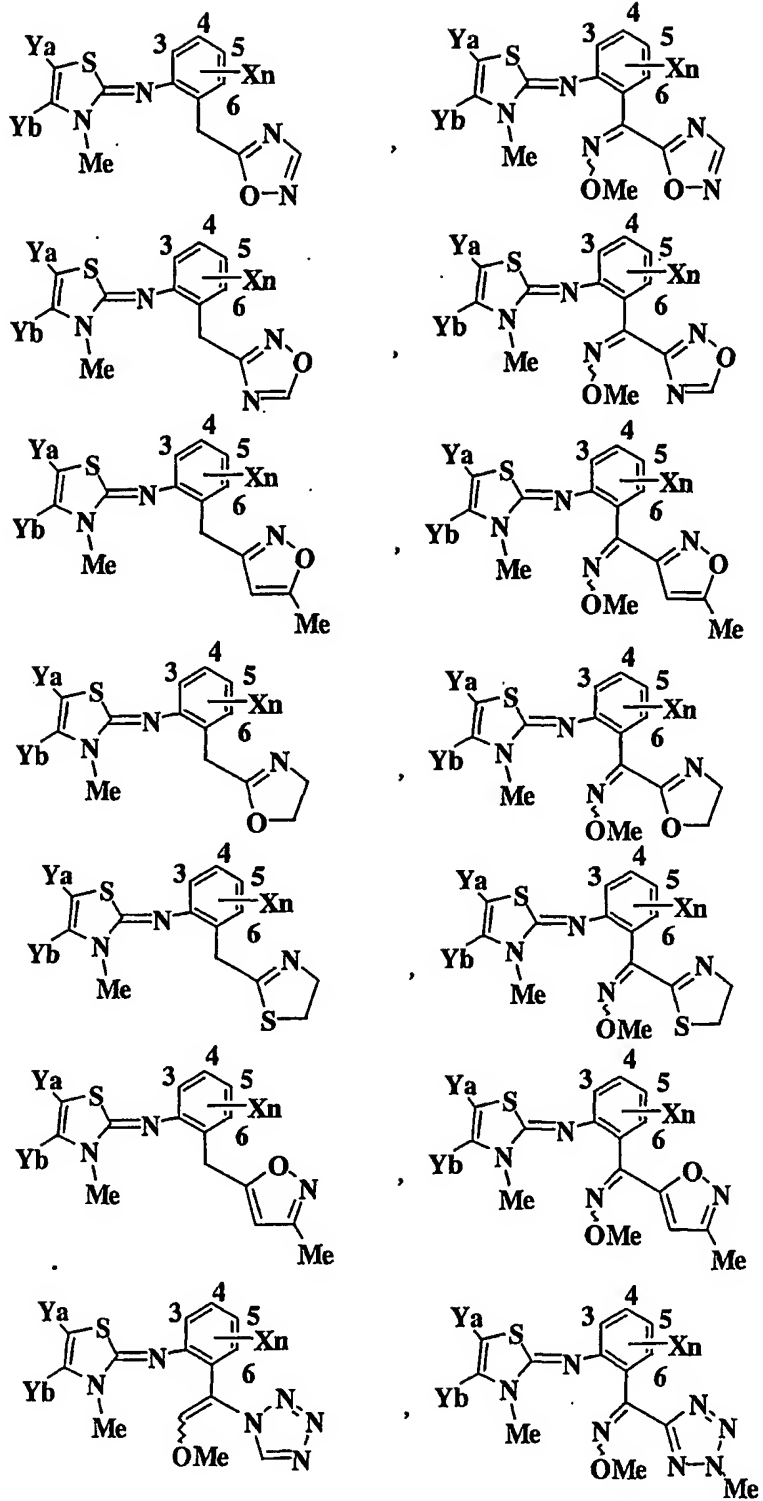
| | | | |
|----|-------------------------|------|-----|
| Me | 4, 5-(OMe) ₂ | N-Me | G17 |
| Et | H | N-Me | G17 |
| Et | 4-Me | N-Me | G17 |
| Et | 6-Me | N-Me | G17 |
| Et | 4-Et | N-Me | G17 |
| Et | 4-OMe | N-Me | G17 |
| Et | 4-F | N-Me | G17 |
| Et | 4-Cl | N-Me | G17 |
| Et | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G17 |
| Pr | H | N-Me | G17 |
| F | H | N-Me | G17 |
| Cl | H | N-Me | G17 |
| Cl | 4-Me | N-Me | G17 |
| Cl | 6-Me | N-Me | G17 |
| Cl | 4-Et | N-Me | G17 |
| Cl | 4-OMe | N-Me | G17 |
| Cl | 4-F | N-Me | G17 |
| Cl | 4-Cl | N-Me | G17 |
| Cl | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G17 |
| Br | H | N-Me | G17 |
| Br | 4-Me | N-Me | G17 |
| Br | 6-Me | N-Me | G17 |
| Br | 4-Et | N-Me | G17 |
| Br | 4-OMe | N-Me | G17 |
| Br | 4-F | N-Me | G17 |
| Br | 4-Cl | N-Me | G17 |
| Br | 4, 6-Me ₂ | N-Me | G17 |

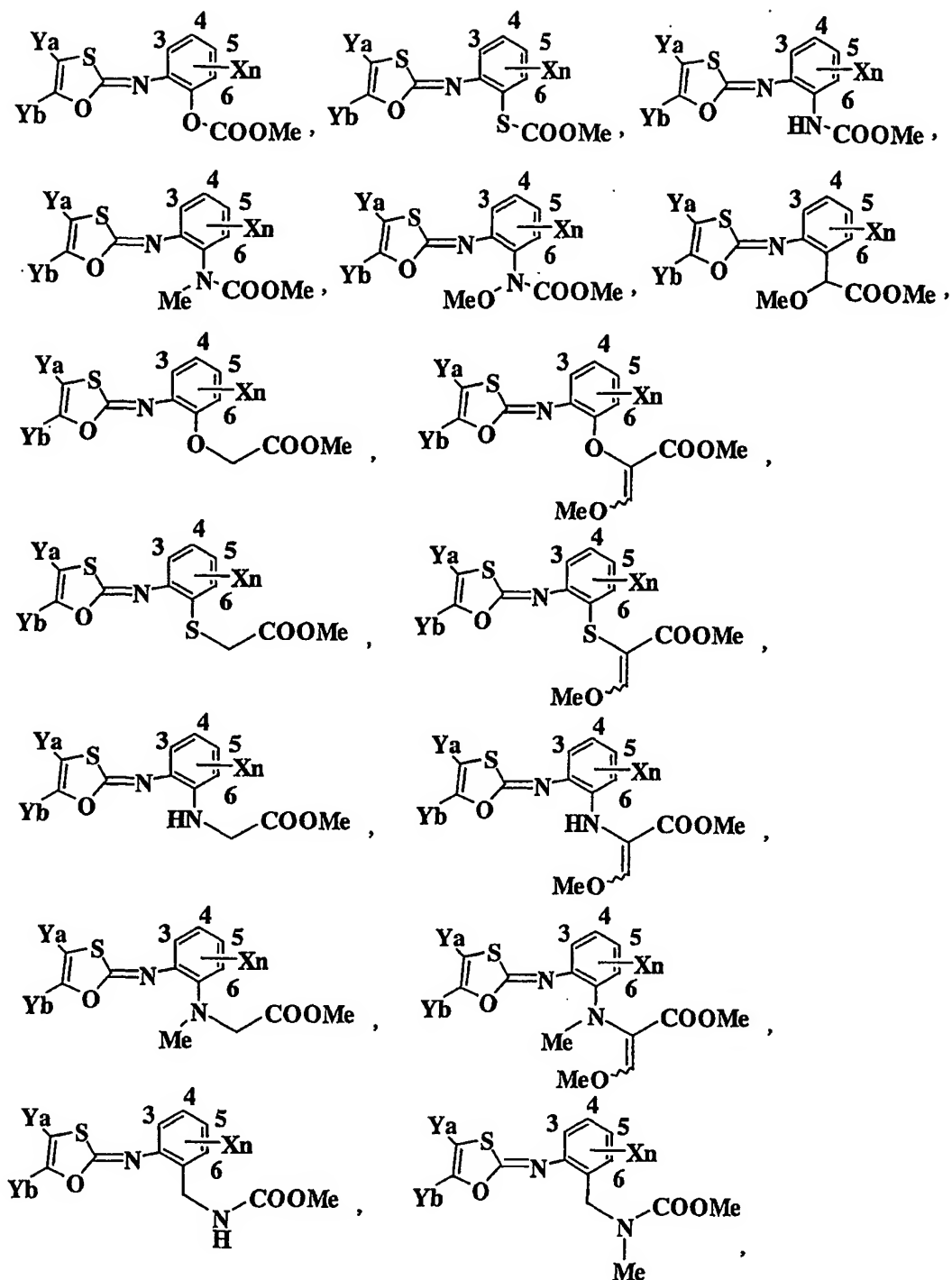
〔第4表〕

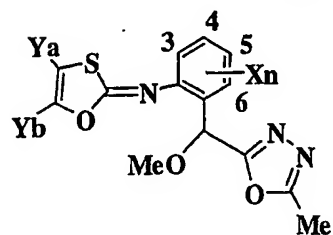
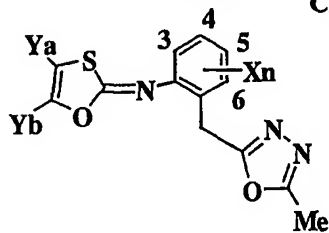
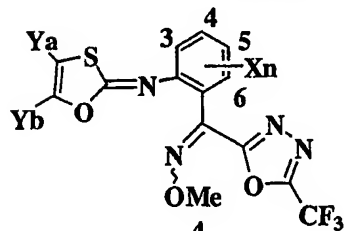
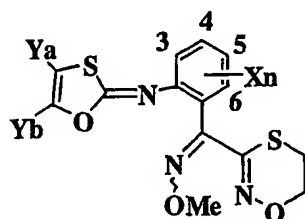
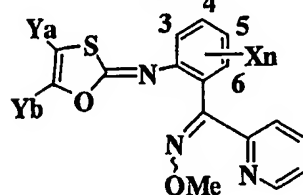
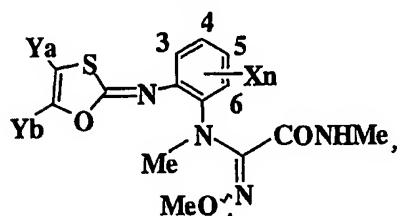
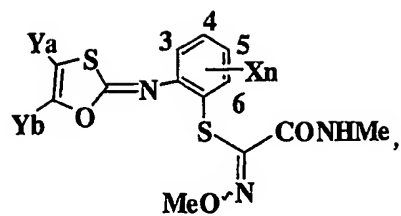


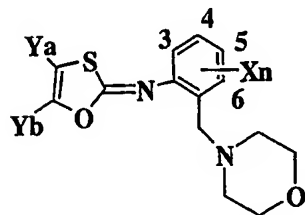
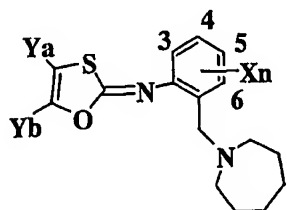
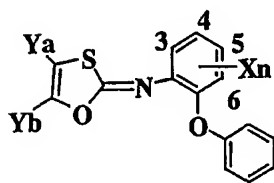
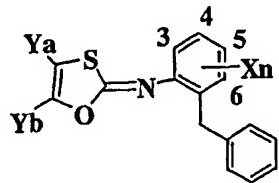
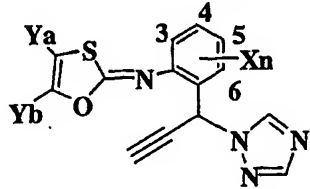
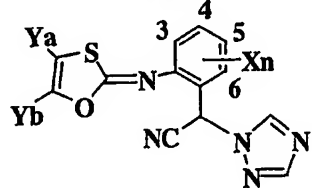
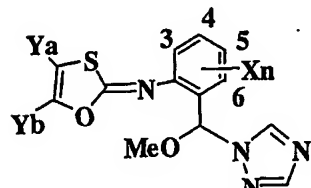
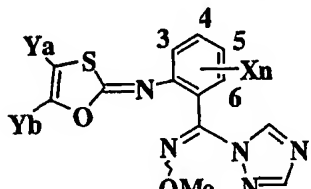
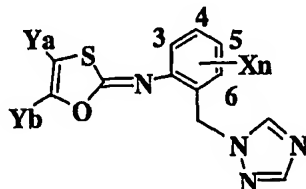
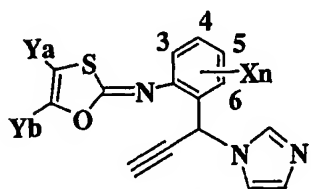
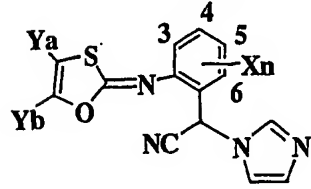
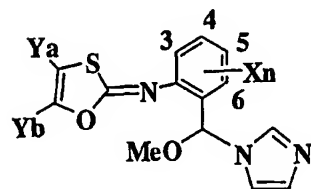
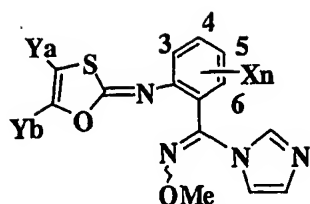
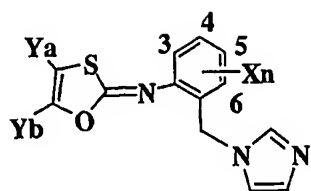


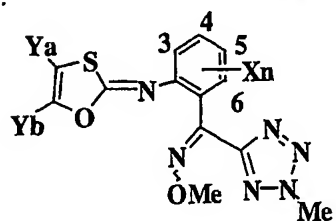


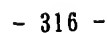


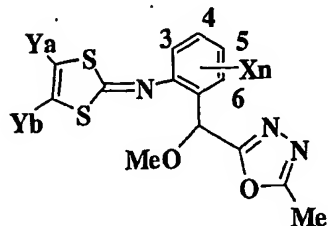
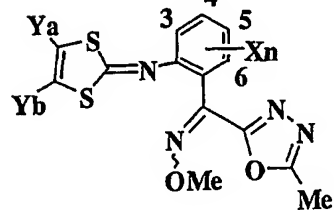
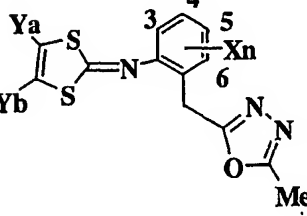
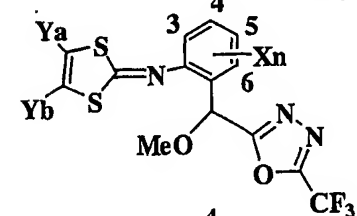
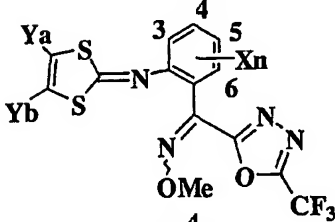
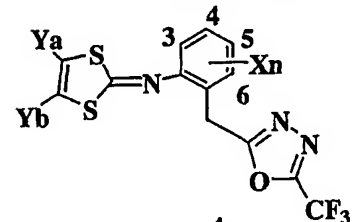
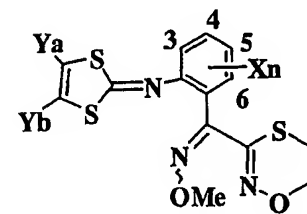
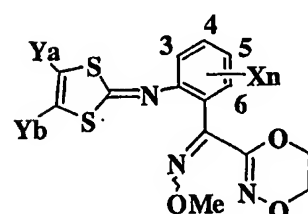
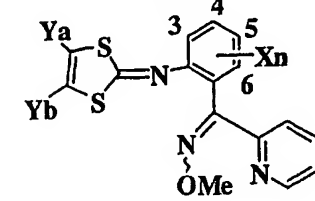
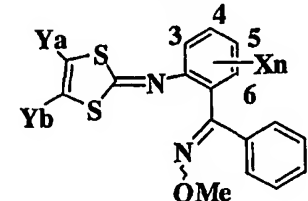
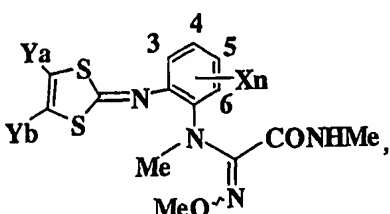
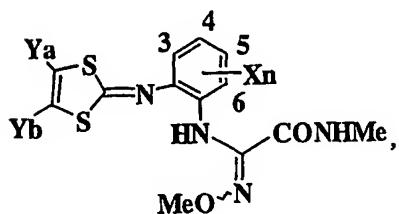
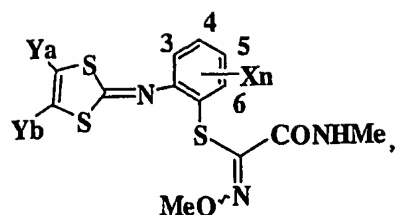
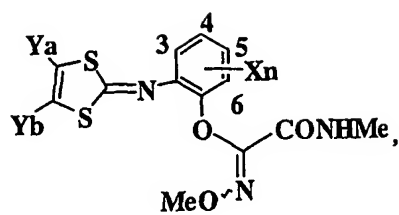


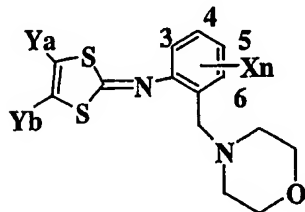
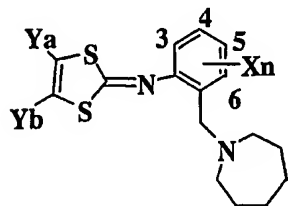
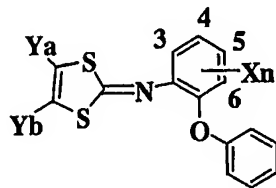
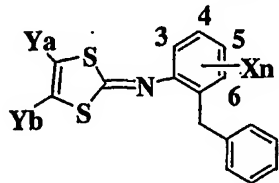
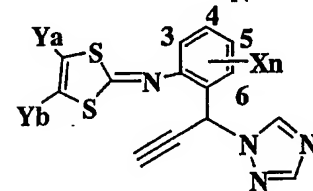
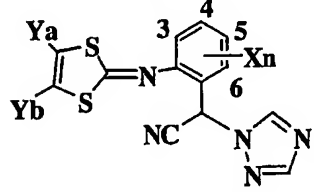
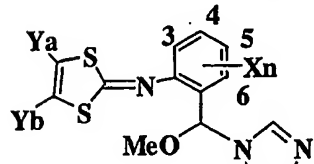
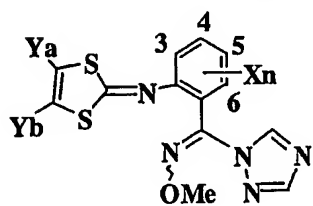
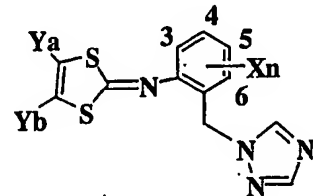
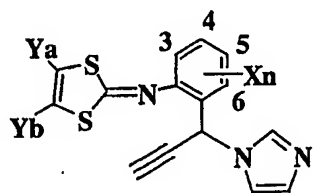
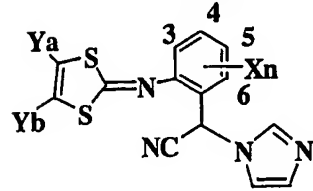
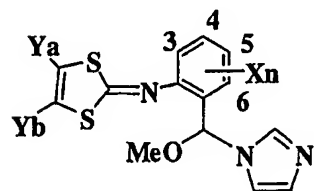
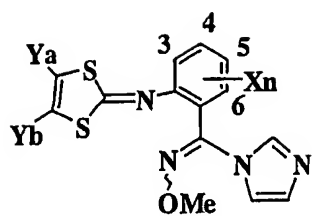
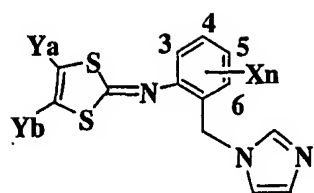


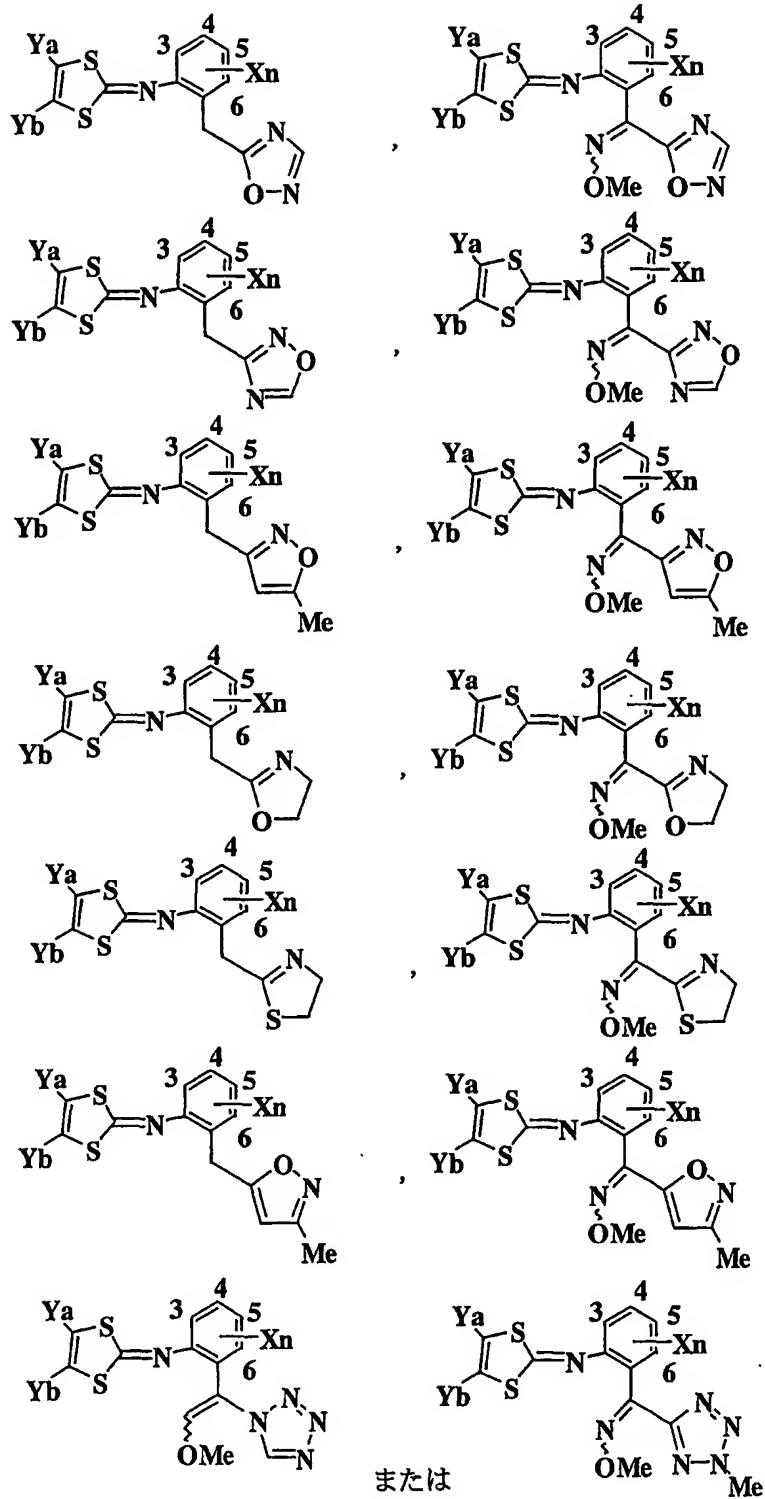












| Y a | Y b | X n |
|-----|-------------------------------------|-----|
| H | H | H |
| H | Br | H |
| H | Me | H |
| H | Et | H |
| H | n-Pr | H |
| H | i-Pr | H |
| H | n-Bu | H |
| H | i-Bu | H |
| H | s-Bu | H |
| H | t-Bu | H |
| H | CF ₃ | H |
| H | c-Pr | H |
| H | PhCH ₂ | H |
| H | PhCH=CH | H |
| H | 4-Cl-PhCH=CH | H |
| H | PhCH=CHCH ₂ | H |
| H | Ph | H |
| H | MeNHC(O) | H |
| H | PhNHC(O) | H |
| H | EtNHC(O) | H |
| H | 2-F-PhNHC(O) | H |
| H | 3-F-PhNHC(O) | H |
| H | 4-F-PhNHC(O) | H |
| H | 2-Cl-PhNHC(O) | H |
| H | 3-Cl-PhNHC(O) | H |
| H | 4-Cl-PhNHC(O) | H |
| H | 2-Me-PhNHC(O) | H |
| H | 3-Me-PhNHC(O) | H |
| H | 4-Me-PhNHC(O) | H |
| H | 2-Br-PhNHC(O) | H |
| H | 3-Br-PhNHC(O) | H |
| H | 4-Br-PhNHC(O) | H |
| H | 2-MeO-PhNHC(O) | H |
| H | 3-MeO-PhNHC(O) | H |
| H | 4-MeO-PhNHC(O) | H |
| H | 2,6-F ₂ -PhNHC(O) | H |
| H | MeOCO | H |
| H | MeOCH ₂ | H |
| H | MeOC(=NOMe) | H |
| H | MeC(=NOMe) | H |
| H | COMe | H |
| H | CH ₂ SMe | H |
| H | CH ₂ SCH ₂ Ph | H |
| H | Pyrazol-1-ylCH ₂ | H |
| H | ClCH ₂ | H |
| H | BrCH ₂ | H |
| H | CF ₃ CF ₂ | H |
| H | PhCONH | H |
| H | 1-Naphthyl | H |
| H | 2-Naphthyl | H |
| H | 1-Me-Pyrazol-5-yl | H |
| H | Thiophen-2-yl | H |
| H | Thiazol-5-yl | H |
| H | Pyridin-4-yl | H |
| H | Quinoxalin-2-yl | H |
| H | 6-Cl-Quinoxalin-2-yl | H |

| | | |
|---|------------------------------|---|
| H | 6-F-Quinoxalin-2-yl | H |
| H | 2-Cl-Ph | H |
| H | 3-Cl-Ph | H |
| H | 4-Cl-Ph | H |
| H | 2-F-Ph | H |
| H | 3-F-Ph | H |
| H | 4-F-Ph | H |
| H | 2-Me-Ph | H |
| H | 3-Me-Ph | H |
| H | 4-Me-Ph | H |
| H | 2-MeO-Ph | H |
| H | 3-MeO-Ph | H |
| H | 4-MeO-Ph | H |
| H | 4-Br-Ph | H |
| H | 2,4-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 3,4-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 2,4,6-Cl ₃ -Ph | H |
| H | 3,4-(MeO) ₂ -Ph | H |
| H | 2-Cl-4-Me-Ph | H |
| H | 2-MeO-4-Me-Ph | H |
| H | 2,4-Me ₂ -Ph | H |
| H | 2,5-Me ₂ -Ph | H |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | H |
| H | 2,3,4,5,6-F ₅ -Ph | H |
| H | 4-Et-Ph | H |
| H | 4-i-Pr-Ph | H |
| H | 4-t-Bu-Ph | H |
| H | 4-CF ₃ -Ph | H |
| H | 4-i-PrO-Ph | H |
| H | 4-t-BuO-Ph | H |
| H | 4-CHF ₂ O-Ph | H |
| H | 4-CF ₃ O-Ph | H |
| H | 4-MeS-Ph | H |
| H | 4-PhCH ₂ O-Ph | H |
| H | 4-Ph-Ph | H |
| H | 4-PhO-Ph | H |
| H | 2,3-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 3,5-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 2,6-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 2,5-Cl ₂ -Ph | H |
| H | 2,3-F ₂ -Ph | H |
| H | 2,5-F ₂ -Ph | H |
| H | 3,4-F ₂ -Ph | H |
| H | 3,5-F ₂ -Ph | H |
| H | 2,4-F ₂ -Ph | H |
| H | 2-CF ₃ -Ph | H |
| H | 2-F-6-CF ₃ -Ph | H |
| H | 2-F-6-Cl-Ph | H |
| H | 2-F-6-Me-Ph | H |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | H |
| H | 2-F-4-Cl-Ph | H |
| H | 2-F-4-CF ₃ -Ph | H |
| H | 2-F-4-Me-Ph | H |
| H | 2-F-4-MeO-Ph | H |
| H | 3-F-4-Cl-Ph | H |
| H | 3-F-4-Me-Ph | H |
| H | 3-F-4-MeO-Ph | H |
| H | 4-F-2-Cl-Ph | H |

| | | |
|---|----------------------------|------------------------|
| H | 4-F-2-Me-Ph | H |
| H | 4-F-2-MeO-Ph | H |
| H | 4-F-3-Cl-Ph | H |
| H | 4-F-3-Me-Ph | H |
| H | 4-F-3-MeO-Ph | H |
| H | 4-I-Ph | H |
| H | 2,6-Me ₂ -Ph | H |
| H | 2,6-(MeO) ₂ -Ph | H |
| H | 3-CF ₃ -Ph | H |
| H | 2-Br-Ph | H |
| H | 3-Br-Ph | H |
| H | 2,3-Me ₂ -Ph | H |
| H | 3,4-Me ₂ -Ph | H |
| H | 3,5-Me ₂ -Ph | H |
| H | Ph | 4-Cl |
| H | Ph | 4-Me |
| H | Ph | 6-Me |
| H | Ph | 4-F |
| H | Ph | 4-MeO |
| H | Ph | 4,5-Me ₂ |
| H | Ph | 4,6-Me ₂ |
| H | Ph | 4,5-(MeO) ₂ |
| H | Ph | 4-t-Bu |
| H | Ph | 4-CN |
| H | Ph | 4-Et |
| H | Ph | 4-COOMe |
| H | Ph | 4-COMe |
| H | Ph | 4-COPh |
| H | 2-Cl-Ph | 4-Cl |
| H | 2-Cl-Ph | 4-CF ₃ |
| H | 2-Cl-Ph | 4-Me |
| H | 2-Cl-Ph | 6-Me |
| H | 2-Cl-Ph | 4-F |
| H | 2-Cl-Ph | 4-MeO |
| H | 2-Cl-Ph | 4-t-Bu |
| H | 2-Cl-Ph | 4-Et |
| H | 3-Cl-Ph | 4-Cl |
| H | 3-Cl-Ph | 4-Me |
| H | 3-Cl-Ph | 6-Me |
| H | 3-Cl-Ph | 4-F |
| H | 3-Cl-Ph | 4-MeO |
| H | 4-Cl-Ph | 4-Cl |
| H | 4-Cl-Ph | 4-Me |
| H | 4-Cl-Ph | 6-Me |
| H | 4-Cl-Ph | 4-F |
| H | 4-Cl-Ph | 4-MeO |
| H | 2-Me-Ph | 4-Cl |
| H | 2-Me-Ph | 4-Me |
| H | 2-Me-Ph | 4-F |
| H | 2-Me-Ph | 4-MeO |
| H | 3-Me-Ph | 4-Cl |
| H | 3-Me-Ph | 4-Me |
| H | 3-Me-Ph | 6-Me |
| H | 3-Me-Ph | 4-F |
| H | 3-Me-Ph | 4-MeO |
| H | 4-Me-Ph | 4-Cl |
| H | 4-Me-Ph | 4-Me |
| H | 4-Me-Ph | 6-Me |

| | | |
|---|------------------------|--------|
| H | 4-Me-Ph | 4-F |
| H | 4-Me-Ph | 4-MeO |
| H | 4-Me-Ph | 4-Et |
| H | 2-F-Ph | 4-Cl |
| H | 2-F-Ph | 4-Me |
| H | 2-F-Ph | 6-Me |
| H | 2-F-Ph | 4-F |
| H | 2-F-Ph | 4-MeO |
| H | 2-F-Ph | 4-Et |
| H | 3-F-Ph | 4-Cl |
| H | 3-F-Ph | 4-Me |
| H | 3-F-Ph | 6-Me |
| H | 3-F-Ph | 4-F |
| H | 3-F-Ph | 4-MeO |
| H | 4-F-Ph | 4-Cl |
| H | 4-F-Ph | 4-Me |
| H | 4-F-Ph | 6-Me |
| H | 4-F-Ph | 4-F |
| H | 4-F-Ph | 4-MeO |
| H | 4-F-Ph | 4-Et |
| H | 2-MeO-Ph | 4-Cl |
| H | 2-MeO-Ph | 4-Me |
| H | 2-MeO-Ph | 6-Me |
| H | 2-MeO-Ph | 4-F |
| H | 2-MeO-Ph | 4-MeO |
| H | 3-MeO-Ph | 4-Cl |
| H | 3-MeO-Ph | 4-Me |
| H | 3-MeO-Ph | 6-Me |
| H | 3-MeO-Ph | 4-F |
| H | 3-MeO-Ph | 4-MeO |
| H | 4-MeO-Ph | 4-Cl |
| H | 4-MeO-Ph | 4-Me |
| H | 4-MeO-Ph | 6-Me |
| H | 4-MeO-Ph | 4-F |
| H | 4-MeO-Ph | 4-MeO |
| H | 2-Br-Ph | 4-Cl |
| H | 2-Br-Ph | 4-Me |
| H | 2-Br-Ph | 6-Me |
| H | 2-Br-Ph | 4-F |
| H | 2-Br-Ph | 4-MeO |
| H | 3-Br-Ph | 4-Cl |
| H | 3-Br-Ph | 4-Me |
| H | 3-Br-Ph | 4-F |
| H | 3-Br-Ph | 4-MeO |
| H | 4-Br-Ph | 4-Cl |
| H | 4-Br-Ph | 4-Me |
| H | 4-Br-Ph | 4-F |
| H | 4-Br-Ph | 4-MeO |
| H | 4-Et-Ph | 4-Cl |
| H | 4-Et-Ph | 4-Me |
| H | 4-Et-Ph | 4-F |
| H | 4-Et-Ph | 4-MeO |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2,6-F ₂ -Ph | 4-t-Bu |

| | | |
|---|--------------------------|-------------------------|
| H | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-COOMe |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-Cl |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-Me |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 6-Me |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-F |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-MeO |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-Me ₂ |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4, 6-Me ₂ |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-(MeO) ₂ |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-t-Bu |
| H | 2-F-4-Me-Ph | 4-Et |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-Cl |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-Me |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 6-Me |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-F |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-MeO |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-Et |
| H | 2-F-4-Et-Ph | 4-Cl |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | 4-Me |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | 6-Me |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | 4-F |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | 6-F |
| H | 2-F-6-MeO-Ph | 4-MeO |
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-F |

| | | |
|----|--|-------|
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| H | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| H | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| H | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| H | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| H | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| H | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| | -(CH ₂) ₃ - | H |
| | -(CH ₂) ₄ - | H |
| | -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ - | H |
| Me | H | H |
| Me | Me | H |
| Me | Et | H |
| Me | n-Pr | H |
| Me | i-Pr | H |

| | | |
|----|-------------------------------------|---|
| Me | n-Bu | H |
| Me | i-Bu | H |
| Me | s-Bu | H |
| Me | t-Bu | H |
| Me | n-Pen | H |
| Me | 3-Me-n-Bu | H |
| Me | n-Hex | H |
| Me | Ethenyl | H |
| Me | 1-Propenyl | H |
| Me | Ethynyl | H |
| Me | CF ₃ | H |
| Me | c-Pr | H |
| Me | c-Hex | H |
| Me | MeO | H |
| Me | MeS | H |
| Me | PhCH ₂ | H |
| Me | PhCH=CH | H |
| Me | 4-Cl-PhCH=CH | H |
| Me | PhCH=CHCH ₂ | H |
| Me | PhCC | H |
| Me | Ph | H |
| Me | MeNHC(O) | H |
| Me | PhNHC(O) | H |
| Me | EtNHC(O) | H |
| Me | 2-F-PhNHC(O) | H |
| Me | 3-F-PhNHC(O) | H |
| Me | 4-F-PhNHC(O) | H |
| Me | 2-Cl-PhNHC(O) | H |
| Me | 3-Cl-PhNHC(O) | H |
| Me | 4-Cl-PhNHC(O) | H |
| Me | 2-Me-PhNHC(O) | H |
| Me | 3-Me-PhNHC(O) | H |
| Me | 4-Me-PhNHC(O) | H |
| Me | 2-Br-PhNHC(O) | H |
| Me | 3-Br-PhNHC(O) | H |
| Me | 4-Br-PhNHC(O) | H |
| Me | 2-MeO-PhNHC(O) | H |
| Me | 3-MeO-PhNHC(O) | H |
| Me | 4-MeO-PhNHC(O) | H |
| Me | 2,6-F ₂ -PhNHC(O) | H |
| Me | MeOCO | H |
| Me | MeOCH ₂ | H |
| Me | MeOC(=NOMe) | H |
| Me | MeC(=NOMe) | H |
| Me | COMe | H |
| Me | CH ₂ SMe | H |
| Me | CH ₂ SCH ₂ Ph | H |
| Me | Pyrazol-1-ylCH ₂ | H |
| Me | ClCH ₂ | H |
| Me | BrCH ₂ | H |
| Me | CF ₃ CF ₂ | H |
| Me | PhCONH | H |
| Me | 1-Naphthyl | H |
| Me | 2-Naphthyl | H |
| Me | 1-Me-Pyrazol-5-yl | H |
| Me | Thiophen-2-yl | H |
| Me | Pyridin-4-yl | H |
| Me | Quinoxalin-2-yl | H |

| | | |
|----|----------------------------------|---|
| Me | 6-Cl-Quinoxalin-2-yl | H |
| Me | Ph | H |
| Me | 2-Cl-Ph | H |
| Me | 3-Cl-Ph | H |
| Me | 4-Cl-Ph | H |
| Me | 2-F-Ph | H |
| Me | 3-F-Ph | H |
| Me | 4-F-Ph | H |
| Me | 2-Me-Ph | H |
| Me | 3-Me-Ph | H |
| Me | 4-Me-Ph | H |
| Me | 2-MeO-Ph | H |
| Me | 3-MeO-Ph | H |
| Me | 4-MeO-Ph | H |
| Me | 4-Br-Ph | H |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 3, 4-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 4, 6-Cl ₃ -Ph | H |
| Me | 3, 4-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 2-Cl-4-Me-Ph | H |
| Me | 2-MeO-4-Me-Ph | H |
| Me | 2, 4-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 5-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 6-F ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 3, 4, 5, 6-F ₅ -Ph | H |
| Me | 4-Et-Ph | H |
| Me | 4-i-Pr-Ph | H |
| Me | 4-t-Bu-Ph | H |
| Me | 4-CF ₃ -Ph | H |
| Me | 4-i-PrO-Ph | H |
| Me | 4-t-BuO-Ph | H |
| Me | 4-CHF ₂ O-Ph | H |
| Me | 4-CF ₃ O-Ph | H |
| Me | 4-MeS-Ph | H |
| Me | 4-CHO-Ph | H |
| Me | 4-NO ₂ -Ph | H |
| Me | 4-CN-Ph | H |
| Me | 4-PhCH ₂ O-Ph | H |
| Me | 4-MeC(O)-Ph | H |
| Me | 4-PhC(O)-Ph | H |
| Me | 4-MeOCH ₂ -Ph | H |
| Me | 4-MeSCH ₂ -Ph | H |
| Me | 4-MeC(O)O-Ph | H |
| Me | 4-Ph-Ph | H |
| Me | 4-PhO-Ph | H |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 5-Cl ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 3-F ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 5-F ₂ -Ph | H |
| Me | 3, 4-F ₂ -Ph | H |
| Me | 3, 5-F ₂ -Ph | H |
| Me | 2, 4-F ₂ -Ph | H |
| Me | 2-CF ₃ -Ph | H |
| Me | 2-F-6-CF ₃ -Ph | H |
| Me | 2-F-6-Cl-Ph | H |
| Me | 2-F-6-Me-Ph | H |

| | | |
|----|----------------------------|------------------------|
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | H |
| Me | 2-F-4-Cl-Ph | H |
| Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | H |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | H |
| Me | 2-F-4-MeO-Ph | H |
| Me | 3-F-4-Cl-Ph | H |
| Me | 3-F-4-Me-Ph | H |
| Me | 3-F-4-MeO-Ph | H |
| Me | 4-F-2-Cl-Ph | H |
| Me | 4-F-2-Me-Ph | H |
| Me | 4-F-2-MeO-Ph | H |
| Me | 4-F-3-Cl-Ph | H |
| Me | 4-F-3-Me-Ph | H |
| Me | 4-F-3-MeO-Ph | H |
| Me | 2-OH-Ph | H |
| Me | 4-I-Ph | H |
| Me | 4-MeOC(O)-Ph | H |
| Me | 2,6-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 2,6-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 3-CF ₃ -Ph | H |
| Me | 2-Br-Ph | H |
| Me | 3-Br-Ph | H |
| Me | 2-MeC(O)-Ph | H |
| Me | 4-c-Pr-Ph | H |
| Me | 4-PhS-Ph | H |
| Me | 2,3-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 3,4-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 3,5-Me ₂ -Ph | H |
| Me | 2,3-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 2,4-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 2,5-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 3,5-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Me | 2-F-4-I-Ph | H |
| Me | 2-F-4-EtO-Ph | H |
| Me | 2-F-6-Ph-Ph | H |
| Me | Ph | 4-Cl |
| Me | Ph | 4-Me |
| Me | Ph | 6-Me |
| Me | Ph | 4-F |
| Me | Ph | 4-MeO |
| Me | Ph | 4,5-Me ₂ |
| Me | Ph | 4,6-Me ₂ |
| Me | Ph | 4,5-(MeO) ₂ |
| Me | Ph | 4-t-Bu |
| Me | Ph | 4-CN |
| Me | Ph | 4-Et |
| Me | Ph | 4-COOMe |
| Me | Ph | 4-COMe |
| Me | Ph | 4-COPh |
| Me | Ph | 4-Cl |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-CF ₃ |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-Me |
| Me | 2-Cl-Ph | 6-Me |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-F |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-MeO |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-t-Bu |
| Me | 2-Cl-Ph | 4-Et |
| Me | 3-Cl-Ph | 4-Cl |

| | | |
|----|----------|-------|
| Me | 3-Cl-Ph | 4-Me |
| Me | 3-Cl-Ph | 6-Me |
| Me | 3-Cl-Ph | 4-F |
| Me | 3-Cl-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-Cl-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-Cl-Ph | 4-Me |
| Me | 4-Cl-Ph | 6-Me |
| Me | 4-Cl-Ph | 4-F |
| Me | 4-Cl-Ph | 4-MeO |
| Me | 2-Me-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-Me-Ph | 4-Me |
| Me | 2-Me-Ph | 4-F |
| Me | 2-Me-Ph | 4-MeO |
| Me | 3-Me-Ph | 4-Cl |
| Me | 3-Me-Ph | 4-Me |
| Me | 3-Me-Ph | 6-Me |
| Me | 3-Me-Ph | 4-F |
| Me | 3-Me-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-Me-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-Me-Ph | 4-Me |
| Me | 4-Me-Ph | 6-Me |
| Me | 4-Me-Ph | 4-F |
| Me | 4-Me-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-Me-Ph | 4-Et |
| Me | 2-F-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-F-Ph | 4-Me |
| Me | 2-F-Ph | 6-Me |
| Me | 2-F-Ph | 4-F |
| Me | 2-F-Ph | 4-MeO |
| Me | 2-F-Ph | 4-Et |
| Me | 3-F-Ph | 4-Cl |
| Me | 3-F-Ph | 4-Me |
| Me | 3-F-Ph | 6-Me |
| Me | 3-F-Ph | 4-F |
| Me | 3-F-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-F-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-F-Ph | 4-Me |
| Me | 4-F-Ph | 6-Me |
| Me | 4-F-Ph | 4-F |
| Me | 4-F-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-F-Ph | 4-Et |
| Me | 2-MeO-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-MeO-Ph | 4-Me |
| Me | 2-MeO-Ph | 6-Me |
| Me | 2-MeO-Ph | 4-F |
| Me | 2-MeO-Ph | 4-MeO |
| Me | 3-MeO-Ph | 4-Cl |
| Me | 3-MeO-Ph | 4-Me |
| Me | 3-MeO-Ph | 6-Me |
| Me | 3-MeO-Ph | 4-F |
| Me | 3-MeO-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-MeO-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-MeO-Ph | 4-Me |
| Me | 4-MeO-Ph | 6-Me |
| Me | 4-MeO-Ph | 4-F |
| Me | 4-MeO-Ph | 4-MeO |
| Me | 2-Br-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-Br-Ph | 4-Me |

| | | |
|----|------------------------|---------|
| Me | 2-Br-Ph | 6-Me |
| Me | 2-Br-Ph | 4-F |
| Me | 2-Br-Ph | 4-MeO |
| Me | 3-Br-Ph | 4-Cl |
| Me | 3-Br-Ph | 4-Me |
| Me | 3-Br-Ph | 4-F |
| Me | 3-Br-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-Br-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-Br-Ph | 4-Me |
| Me | 4-Br-Ph | 4-F |
| Me | 4-Br-Ph | 4-MeO |
| Me | 4-Et-Ph | 4-Cl |
| Me | 4-Et-Ph | 4-Me |
| Me | 4-Et-Ph | 4-F |
| Me | 4-Et-Ph | 4-MeO |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-t-Bu |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2,6-F ₂ -Ph | 4-COOMe |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2,5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2,4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2,3-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3,4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3,5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-Me |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 6-Me |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-F |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-MeO |

| | | |
|----|--------------------------|-------------------------|
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-Me ₂ |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4, 6-Me ₂ |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-(MeO) ₂ |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-t-Bu |
| Me | 2-F-4-Me-Ph | 4-Et |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 4-Me |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 6-Me |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 4-F |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 4-MeO |
| Me | 2-F-4-Et-Ph | 4-Et |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 4-Cl |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 4-Me |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 6-Me |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 4-F |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 6-F |
| Me | 2-F-6-MeO-Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-F |

| | | |
|----|---------------------------------|-------|
| Me | 2,4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 2,3-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 2,3-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 2,3-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 2,3-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3,4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3,4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3,4-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3,4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Me | 3,5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Me | 3,5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Me | 3,5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Me | 3,5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | Et | H |
| Et | n-Pr | H |
| Et | i-Pr | H |
| Et | n-Bu | H |
| Et | s-Bu | H |
| Et | t-Bu | H |
| Et | CF ₃ | H |
| Et | CF ₂ CF ₃ | H |
| Et | 1-Naphthyl | H |
| Et | 2-Naphthyl | H |
| Et | Ph | H |
| Et | 2-Cl-Ph | H |
| Et | 4-Cl-Ph | H |
| Et | 2-F-Ph | H |
| Et | 4-F-Ph | H |
| Et | 2-Me-Ph | H |
| Et | 3-Me-Ph | H |
| Et | 4-Me-Ph | H |
| Et | 2-MeO-Ph | H |
| Et | 3-MeO-Ph | H |
| Et | 4-MeO-Ph | H |
| Et | 4-Br-Ph | H |
| Et | 4-Ph-Ph | H |
| Et | 4-PhO-Ph | H |
| Et | 2,3-F ₂ -Ph | H |
| Et | 2,5-F ₂ -Ph | H |
| Et | 3,4-F ₂ -Ph | H |
| Et | 3,5-F ₂ -Ph | H |
| Et | 2,4-F ₂ -Ph | H |
| Et | 2-F-4-Cl-Ph | H |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | H |
| Et | 2-F-4-MeO-Ph | H |
| Et | 3-F-4-Cl-Ph | H |
| Et | 3-F-4-Me-Ph | H |
| Et | 3-F-4-MeO-Ph | H |
| Et | 4-F-2-Cl-Ph | H |
| Et | 4-F-2-Me-Ph | H |
| Et | 4-F-2-MeO-Ph | H |
| Et | 4-F-3-Cl-Ph | H |
| Et | 4-F-3-Me-Ph | H |
| Et | 4-F-3-MeO-Ph | H |
| Et | 2,6-(MeO) ₂ -Ph | H |
| Et | 2-Br-Ph | H |
| Et | 3-Br-Ph | H |
| Et | 4-EtO-Ph | H |

| | | |
|----|-----------------------------|--------|
| Et | 2, 3-Me ₂ -Ph | H |
| Et | 3, 4-Me ₂ -Ph | H |
| Et | 3, 5-Me ₂ -Ph | H |
| Et | 2-Cl-3-Me-Ph | H |
| Et | 2-Cl-4-Me-Ph | H |
| Et | 3-Cl-4-Me-Ph | H |
| Et | 4-Cl-2-Me-Ph | H |
| Et | 4-Cl-3-Me-Ph | H |
| Et | 2, 4, 6-Me ₃ -Ph | H |
| Et | Ph | 4-Cl |
| Et | Ph | 4-Me |
| Et | Ph | 6-Me |
| Et | Ph | 4-F |
| Et | Ph | 4-MeO |
| Et | Ph | 4-t-Bu |
| Et | Ph | 4-Et |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-Me |
| Et | 2-Cl-Ph | 6-Me |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-F |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-t-Bu |
| Et | 2-Cl-Ph | 4-Et |
| Et | 3-Cl-Ph | 4-Cl |
| Et | 3-Cl-Ph | 4-Me |
| Et | 3-Cl-Ph | 6-Me |
| Et | 3-Cl-Ph | 4-F |
| Et | 3-Cl-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-Cl-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-Cl-Ph | 4-Me |
| Et | 4-Cl-Ph | 6-Me |
| Et | 4-Cl-Ph | 4-F |
| Et | 4-Cl-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-Me-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-Me-Ph | 4-Me |
| Et | 2-Me-Ph | 4-F |
| Et | 2-Me-Ph | 4-MeO |
| Et | 3-Me-Ph | 4-Cl |
| Et | 3-Me-Ph | 4-Me |
| Et | 3-Me-Ph | 6-Me |
| Et | 3-Me-Ph | 4-F |
| Et | 3-Me-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-Me-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-Me-Ph | 4-Me |
| Et | 4-Me-Ph | 6-Me |
| Et | 4-Me-Ph | 4-F |
| Et | 4-Me-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-Me-Ph | 4-Et |
| Et | 2-F-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-F-Ph | 4-Me |
| Et | 2-F-Ph | 6-Me |
| Et | 2-F-Ph | 4-F |
| Et | 2-F-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-F-Ph | 4-Et |
| Et | 3-F-Ph | 4-Cl |
| Et | 3-F-Ph | 4-Me |
| Et | 3-F-Ph | 6-Me |
| Et | 3-F-Ph | 4-F |

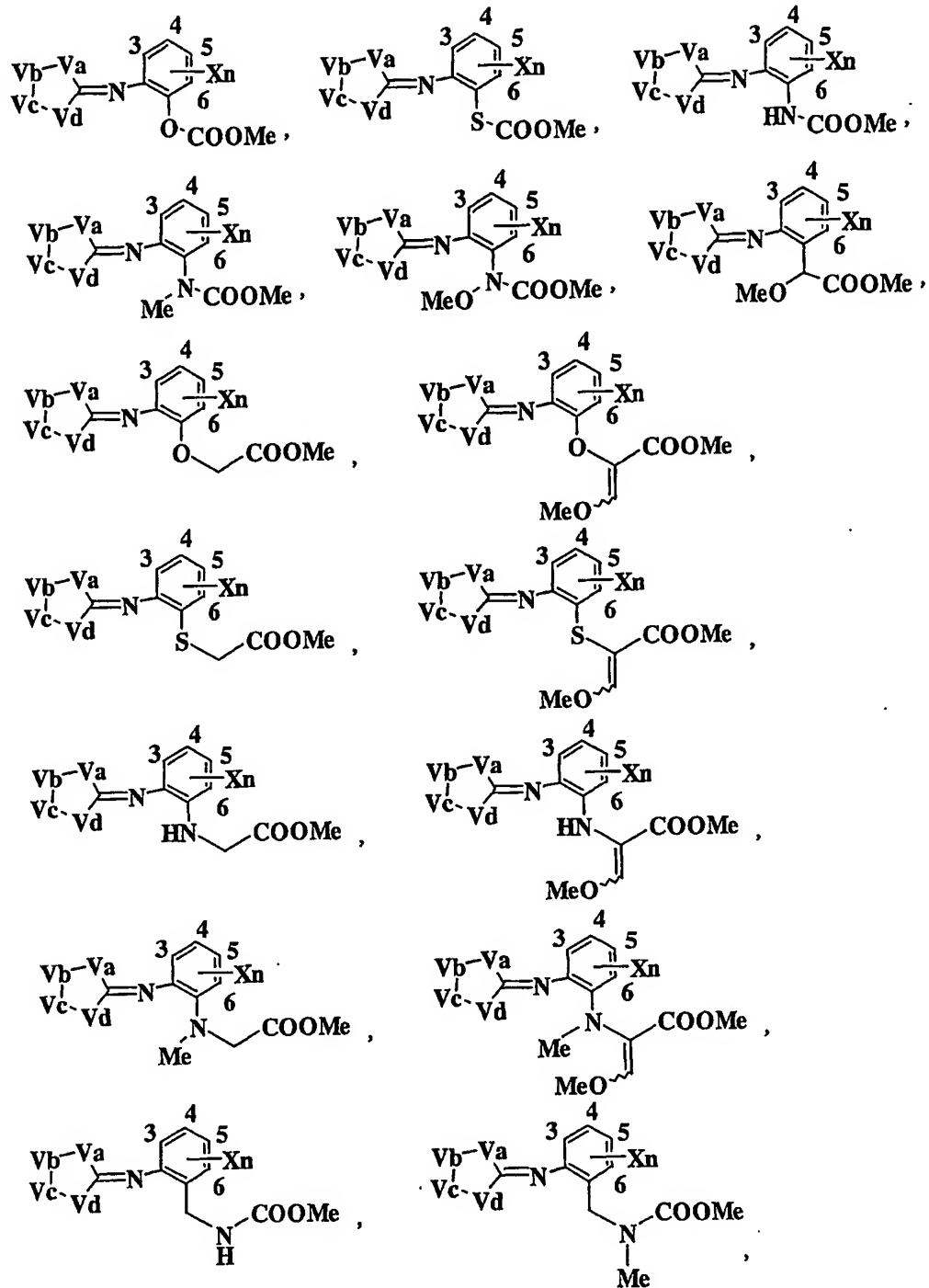
| | | |
|----|-------------------------|---------|
| Et | 3-F-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-F-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-F-Ph | 4-Me |
| Et | 4-F-Ph | 6-Me |
| Et | 4-F-Ph | 4-F |
| Et | 4-F-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-F-Ph | 4-Et |
| Et | 2-MeO-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-MeO-Ph | 4-Me |
| Et | 2-MeO-Ph | 6-Me |
| Et | 2-MeO-Ph | 4-F |
| Et | 2-MeO-Ph | 4-MeO |
| Et | 3-MeO-Ph | 4-Cl |
| Et | 3-MeO-Ph | 4-Me |
| Et | 3-MeO-Ph | 6-Me |
| Et | 3-MeO-Ph | 4-F |
| Et | 3-MeO-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-MeO-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-MeO-Ph | 4-Me |
| Et | 4-MeO-Ph | 6-Me |
| Et | 4-MeO-Ph | 4-F |
| Et | 4-MeO-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-Br-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-Br-Ph | 4-Me |
| Et | 2-Br-Ph | 6-Me |
| Et | 2-Br-Ph | 4-F |
| Et | 2-Br-Ph | 4-MeO |
| Et | 3-Br-Ph | 4-Cl |
| Et | 3-Br-Ph | 4-Me |
| Et | 3-Br-Ph | 4-F |
| Et | 3-Br-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-Br-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-Br-Ph | 4-Me |
| Et | 4-Br-Ph | 4-F |
| Et | 4-Br-Ph | 4-MeO |
| Et | 4-Et-Ph | 4-Cl |
| Et | 4-Et-Ph | 4-Me |
| Et | 4-Et-Ph | 4-F |
| Et | 4-Et-Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-t-Bu |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2, 6-F ₂ -Ph | 4-COOMe |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-MeO |

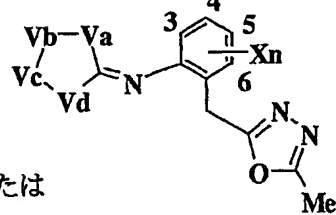
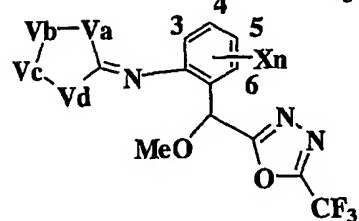
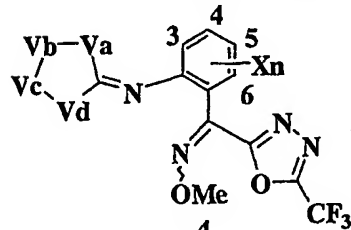
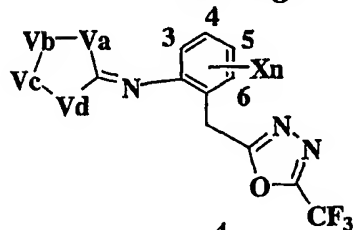
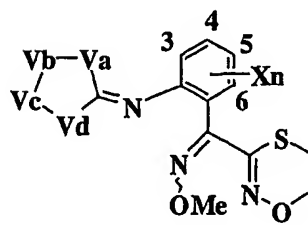
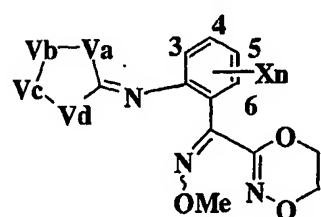
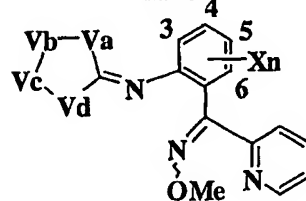
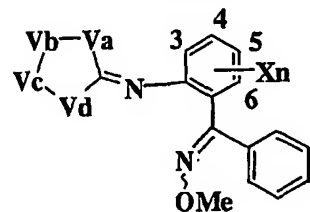
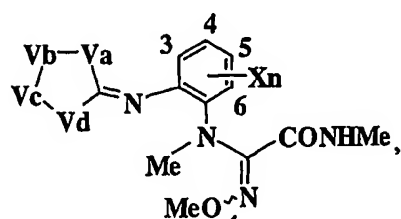
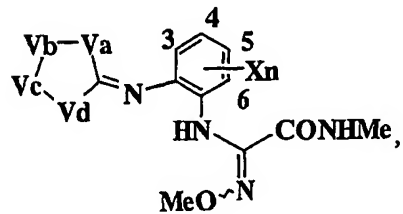
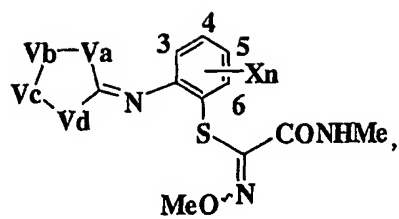
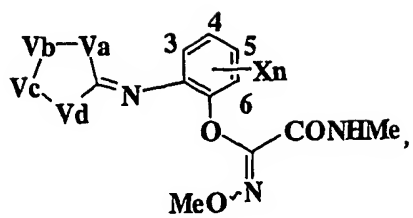
| | | |
|----|--------------------------|-------------------------|
| Et | 2, 4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 3-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 4-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 5-F ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-Me |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 6-Me |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-F |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-Me ₂ |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4, 6-Me ₂ |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4, 5-(MeO) ₂ |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-t-Bu |
| Et | 2-F-4-Me-Ph | 4-Et |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 4-Cl |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 4-Me |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 6-Me |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 4-F |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 4-MeO |
| Et | 2-F-4-Et-Ph | 4-Et |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 6-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Et |
| Et | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 3-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-Me |

| | | |
|----|---------------------------------|-------|
| Et | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 4-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 6-Me |
| Et | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 5-Cl ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 6-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 2, 3-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 4-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Et | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-Cl |
| Et | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-Me |
| Et | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-F |
| Et | 3, 5-Me ₂ -Ph | 4-MeO |
| Pr | Et | H |
| Pr | n-Pr | H |
| Pr | i-Pr | H |
| Pr | s-Bu | H |
| Pr | t-Bu | H |
| Pr | CF ₃ | H |
| Pr | Ph | H |
| Pr | 2-Cl-Ph | H |
| Pr | 4-Cl-Ph | H |
| Pr | 2-F-Ph | H |
| Pr | 4-F-Ph | H |
| Pr | 2-Me-Ph | H |
| Pr | 4-Me-Ph | H |
| Pr | 4-Br-Ph | H |
| Pr | 2, 6-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 2, 3-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 2, 5-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 3, 4-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 3, 5-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 2, 4-F ₂ -Ph | H |
| Pr | 2-Br-Ph | H |
| Br | n-Pr | H |
| Br | i-Pr | H |
| Br | s-Bu | H |
| Br | t-Bu | H |
| Br | CF ₃ | H |
| Br | CF ₂ CF ₃ | H |

| | | |
|------|---------------------------------|---|
| Br | Ph | H |
| Br | 2-Cl-Ph | H |
| Br | 4-Cl-Ph | H |
| Br | 2-F-Ph | H |
| Br | 4-F-Ph | H |
| Br | 2-Me-Ph | H |
| Br | 4-Me-Ph | H |
| Br | 4-Br-Ph | H |
| i-Pr | i-Pr | H |
| i-Pr | s-Bu | H |
| i-Pr | t-Bu | H |
| i-Pr | CF ₃ | H |
| i-Pr | CF ₂ CF ₃ | H |
| i-Pr | Ph | H |
| i-Pr | 2-Cl-Ph | H |
| i-Pr | 4-Cl-Ph | H |
| i-Pr | 2-F-Ph | H |
| i-Pr | 4-F-Ph | H |
| i-Pr | 2-Me-Ph | H |
| i-Pr | 4-Me-Ph | H |
| i-Pr | 4-Br-Ph | H |
| i-Pr | 2-Br-Ph | H |

〔第 5 表〕





または

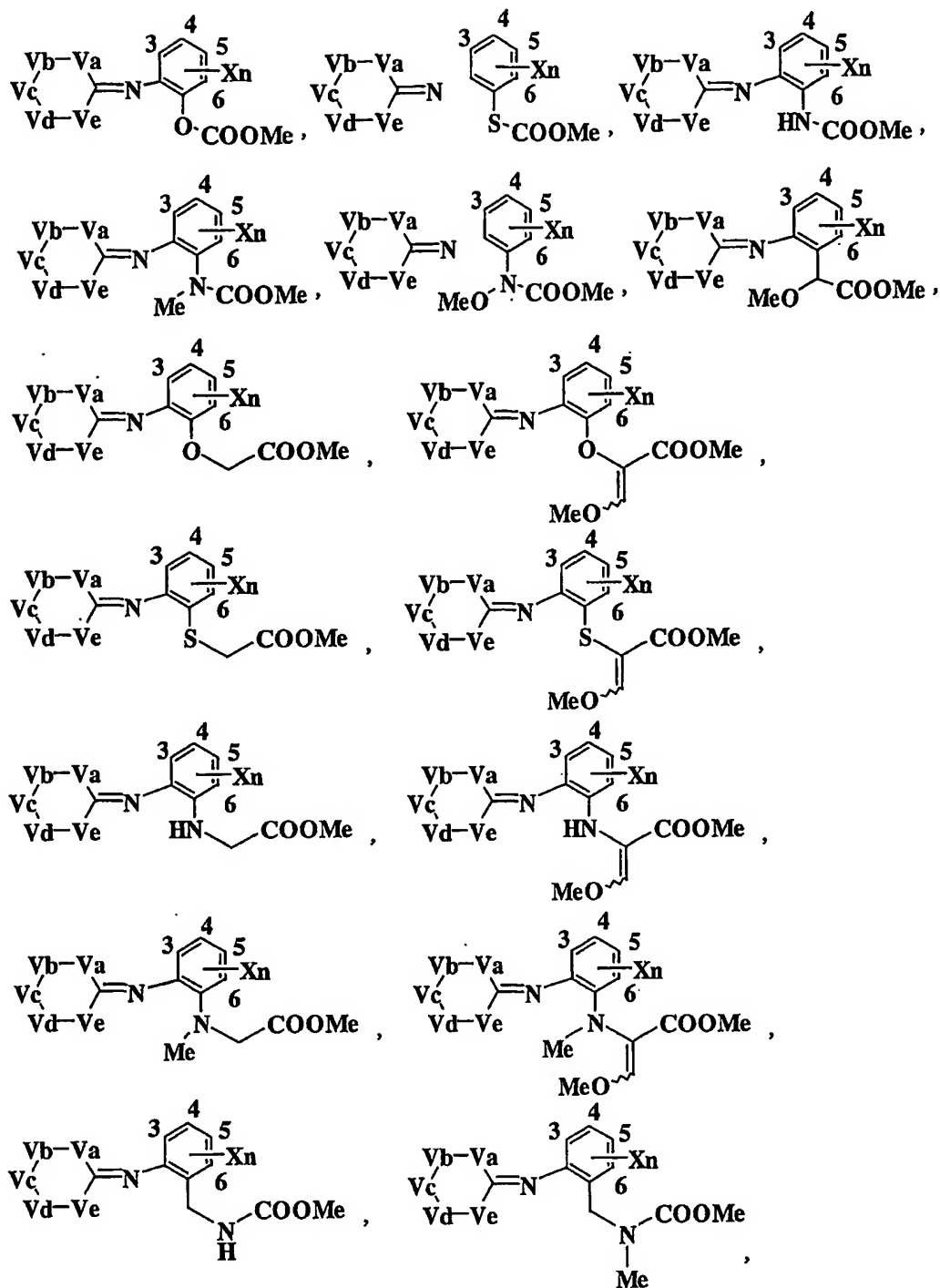
| -Va-Vb-Vc-Vd- | X n |
|--|-----|
| -S-CH ₂ -C(OH)(C ₂ F ₅)-N(Me)- | H |
| -S-CH(CH ₂ Br)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-S-CH=N- | H |
| -S-S-C(Ph)=N- | H |

| | |
|--|---|
| -S-S-C(CF ₃)=N- | H |
| -S-N(Me)-CH ₂ -S- | H |
| -S-N(Ph)-CH ₂ -S- | H |
| -S-N(Me)-CH(Ph)-S- | H |
| -N=N-C(=O)-O- | H |
| -N=N-CH(Me)-O- | H |
| -N=N-CH(Ph)-O- | H |
| -S-O-CH=N- | H |
| -S-O-C(Me)=N- | H |
| -S-O-C(Ph)=N- | H |
| -CH=CH-N(Me)-S- | H |
| -CH=CH-N(Ph)-S- | H |
| -C(Me)=CH-N(Ph)-S- | H |
| -CH=C(Me)-N(Ph)-S- | H |
| -C(Me)=C(Me)-N(Ph)-S- | H |
| -CH=CH-N(Me)-O- | H |
| -CH=CH-N(Ph)-O- | H |
| -C(Me)=CH-N(Ph)-O- | H |
| -CH=C(Me)-N(Ph)-O- | H |
| -C(Me)=C(Me)-N(Ph)-O- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-O- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N(Ph)-O- | H |
| -CH ₂ -C(=O)-N(Ph)-O- | H |
| -CH=N-N(Me)-CH ₂ - | H |
| -CH=N-N(Ph)-CH ₂ - | H |
| -CH=N-N(Ph)-C(=O)- | H |
| -C(Me)=N-N(Ph)-C(=O)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-O- | H |
| -N(Me)-C(=O)-N(Ph)-O- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-S- | H |
| -N(Me)-C(=O)-N(Ph)-S- | H |
| -S-CH ₂ -C(Ph)=N- | H |
| -S-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-C(=O)-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -C(Ph)=N- | H |
| -O-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)- | H |
| -O-C(=O)-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -O-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -N=C(Me)-N=N- | H |
| -N=C(Ph)-N=N- | H |
| -N=CH-CH=N- | H |
| -N=C(Ph)-CH=N- | H |
| -S-N(Me)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-N(Ph)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-N(Me)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-N(Ph)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-N(Me)- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N(Ph)-N(Me)- | H |
| -CH ₂ -C(Ph)=N-N(Me)- | H |
| -CH=C(Ph)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -CH=CH-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -CH=C(Ph)-N=N- | H |
| -CH=N-C(Ph)=N- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N=N- | H |
| -N(Me)-O-CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -C(Ph)=N- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O- | H |

| | |
|--|---|
| -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -S- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -CH=CH-CH ₂ -O- | H |
| -CH=CH-CH ₂ -S- | H |
| -CH=CH-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -CH ₂ -S-C(=N-Ph)-N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -O-CH=CH-N(Me)- | H |
| -O-CH=CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=CH-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH=N-N(Me)- | H |
| -S-C(Ph)=N-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -N=N- | H |
| -S-CH(Ph)-N=N- | H |
| -O-CH=N-N(Me)- | H |
| -O-C(Ph)=N-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Me)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH(Me)-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=N-N(Me)- | H |
| -N(Me)-C(Ph)=N-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=N-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=N-N(Me)- | H |
| -N=CH-N(Me)-N(Me)- | H |
| -N=C(Ph)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N(Me)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-N=CH-N(Me)- | H |
| -S-N=C(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-N(Me)-CH=N- | H |
| -S-N(Ph)-C(Ph)=N- | H |
| -S-N(Me)-C(Ph)=N- | H |
| -S-N(Ph)-CH=N- | H |
| -O-N=CH-N(Me)- | H |
| -O-N=C(Ph)-N(Me)- | H |
| -O-N(Me)-CH=N- | H |
| -O-N(Ph)-C(Ph)=N- | H |
| -O-N(Me)-C(Ph)=N- | H |
| -O-N(Ph)-CH=N- | H |
| -N(Me)-O-CH=N- | H |
| -N(Ph)-O-C(Ph)=N- | H |
| -N(Me)-O-C(Ph)=N- | H |
| -N(Ph)-O-CH=N- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N=N- | H |
| -N(Me)-CH(Ph)-N=N- | H |
| -S-N=CH-S- | H |
| -S-N=C(Ph)-S- | H |
| -O-CH=CH-O- | H |
| -O-C(Me)=CH-O- | H |
| -O-C(Ph)=CH-O- | H |
| -O-C(Me)=C(Ph)-O- | H |
| -O-CH ₂ -CH ₂ -O- | H |
| -O-CH ₂ -CH(Ph)-O- | H |

| | |
|---|---|
| -O-CH(Ph)-CH(Me)-O- | H |
| -S-CH ₂ -CH ₂ -O- | H |
| -S-CH ₂ -CH(Ph)-O- | H |
| -S-CH(Ph)-CH(Me)-O- | H |
| -S-CH(Me)-CH(Ph)-O- | H |
| -S-CH(Ph)-CH ₂ -O- | H |
| -S-CH ₂ -CH ₂ -S- | H |
| -S-CH ₂ -CH(Ph)-S- | H |
| -S-CH(Ph)-CH(Me)-S- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -O- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH(Ph)-O- | H |
| -N(Me)-CH(Ph)-CH(Me)-O- | H |
| -N(Me)-CH(Me)-CH(Ph)-O- | H |
| -N(Me)-CH(Ph)-CH ₂ -O- | H |
| -CH ₂ -N=CH-S- | H |
| -CH ₂ -N=C(Ph)-S- | H |
| -CH ₂ -S-CH=N- | H |
| -CH ₂ -S-C(Ph)=N- | H |
| -CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -S- | H |
| -CH ₂ -N(Me)-CH(Ph)-S- | H |
| -CH ₂ -N(Ph)-CH ₂ -S- | H |
| -CH ₂ -N(Ph)-CH(Ph)-S- | H |

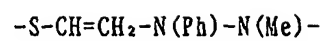
〔第 6 表〕





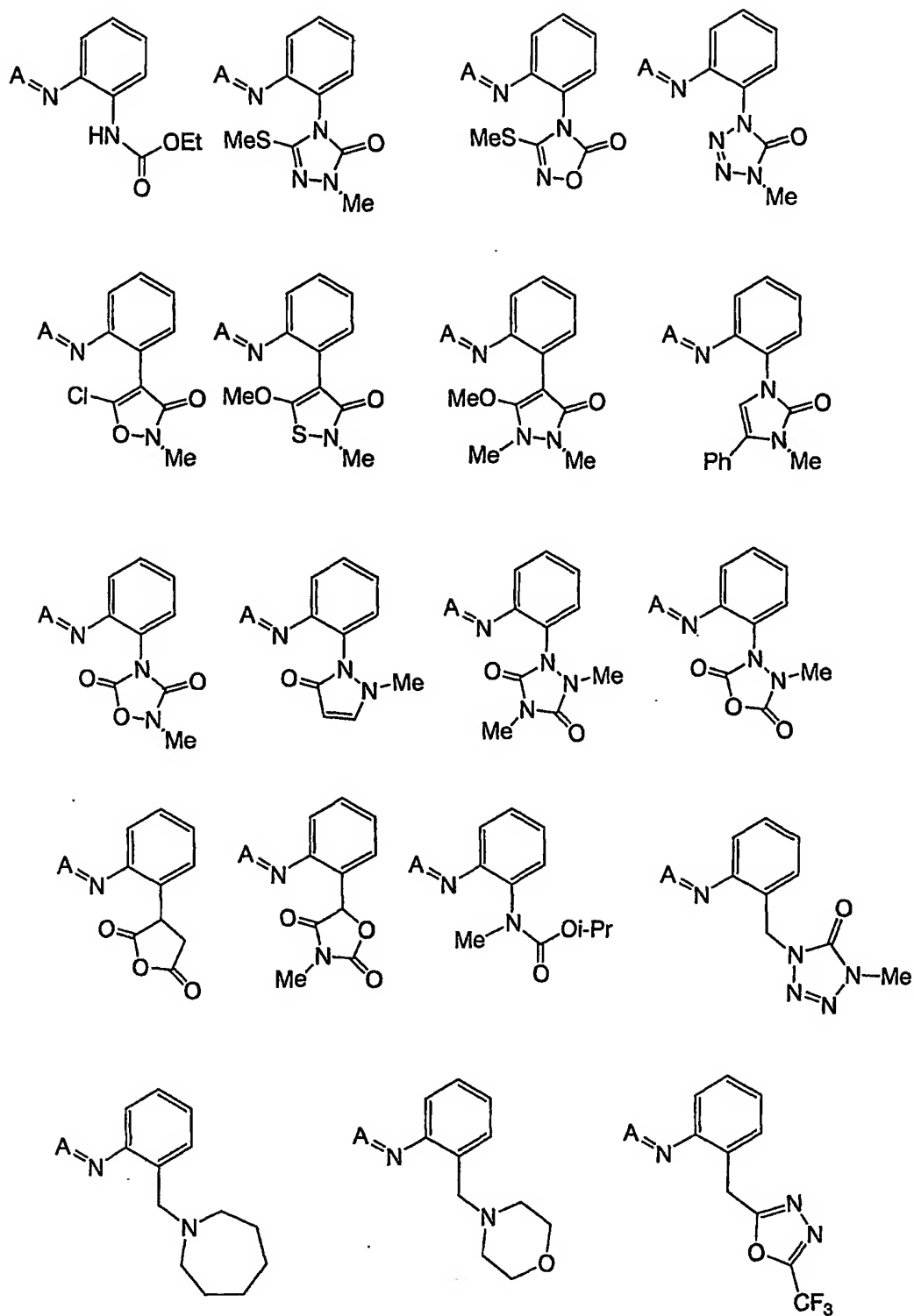
| -Va-Vb-Vc-Vd-Ve- | X |
|------------------------------------|---|
| -S-CH ₂ -CH=N-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH=N-N(Ph)- | H |
| -S-CH ₂ -C(Me)=N-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -C(Ph)=N-N(Me)- | H |

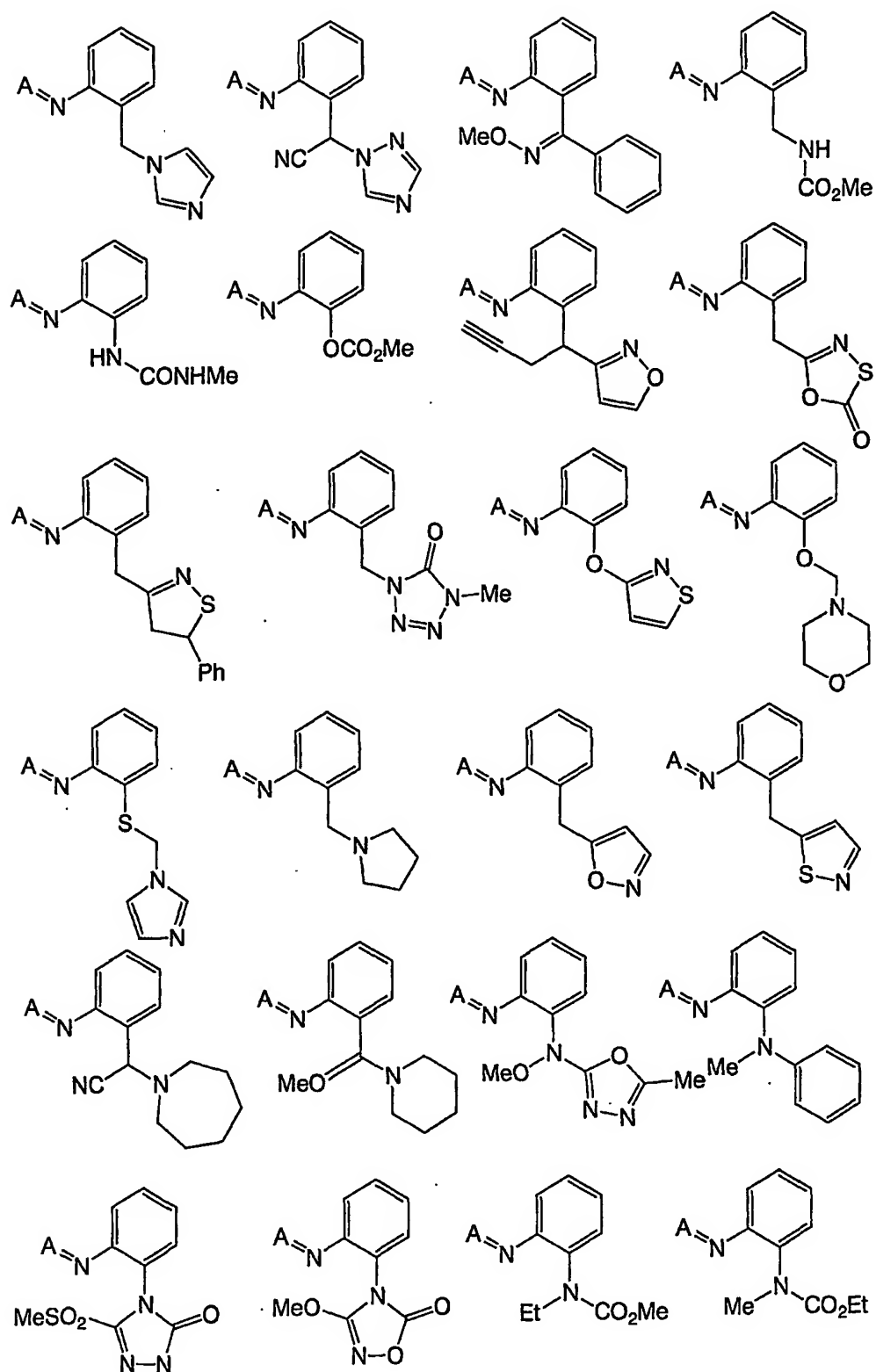
| | |
|---|---|
| -S-C(=O)-CH ₂ -N(Me)-N(Me)- | H |
| -S-C(=O)-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH=C(Me)-N(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-C(=O)-C(Me)=N-N(Me)- | H |
| -S-C(=O)-C(Ph)=N-N(Me)- | H |
| -CH ₂ -S-CH=CH-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=C(F)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=C(Cl)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=C(Br)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=C(Ph)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=C(OPh)-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=CH-N(Et)- | H |
| -N=CH-N=CH-N(Pr)- | H |
| -N=CH-N=C(CF ₃)-N(Me)- | H |
| -N=C(Cl)-N=CH-N(Me)- | H |
| -N=CH-N=CH-N(Me)- | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ - | H |
| -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ - | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH=CH-S- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -C(Ph)=CH-S- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH=C(Ph)-S- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH=CH-O- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -C(Ph)=CH-O- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH=C(Ph)-O- | H |
| -N=CH-CH=CH-S- | H |
| -N=CH-C(Ph)=CH-S- | H |
| -N=CH-CH=C(Ph)-S- | H |
| -N=CH-CH=CH-O- | H |
| -N=CH-C(Ph)=CH-O- | H |
| -N=CH-CH=C(Ph)-O- | H |
| -S-CH ₂ -C(=O)-N(Me)-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -C(=O)-NPh-N(Me)- | H |
| -S-CH=CH-CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -CH=CH-CH=C(Ph)-N(-OMe)- | H |
| -CH=CH-CH=C(F)-N(-OMe)- | H |
| -CH=CH-CH=C(Cl)-N(-OMe)- | H |
| -CH=CH-CH=C(OPh)-N(-OMe)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -S-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -S-CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH=CH-CH=N- | H |
| -N(Me)-C(Ph)=CH-CH=N- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -O-CH ₂ -CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -N(Me)-CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -O-CH ₂ -N(Me)- | H |
| -N(Me)-CH ₂ -O-CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH=CH ₂ -N(Me)- | H |
| -S-CH ₂ -CH=CH(Ph)-N(Me)- | H |
| -S-CH=CH ₂ -N(Me)-N(Me)- | H |



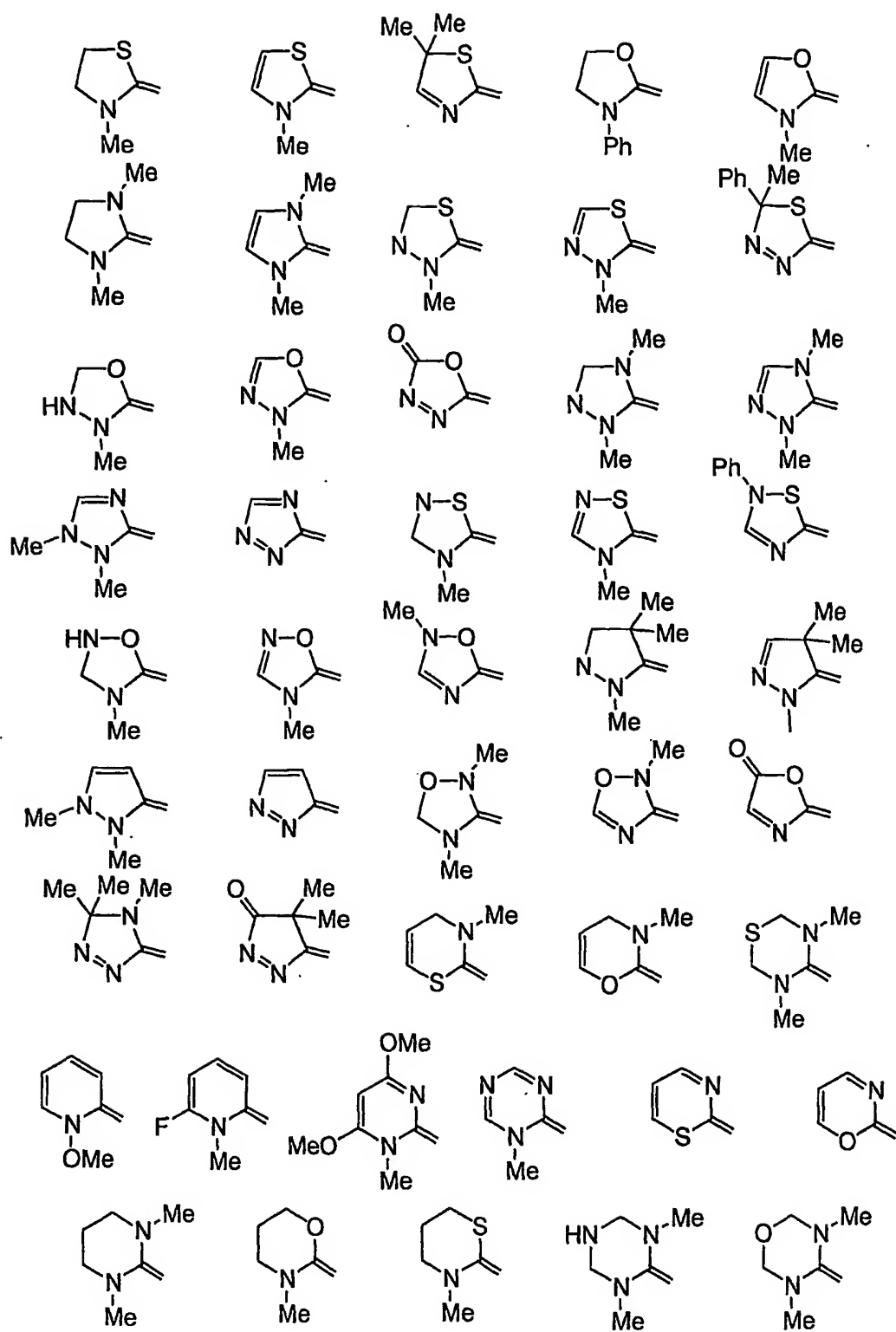
H

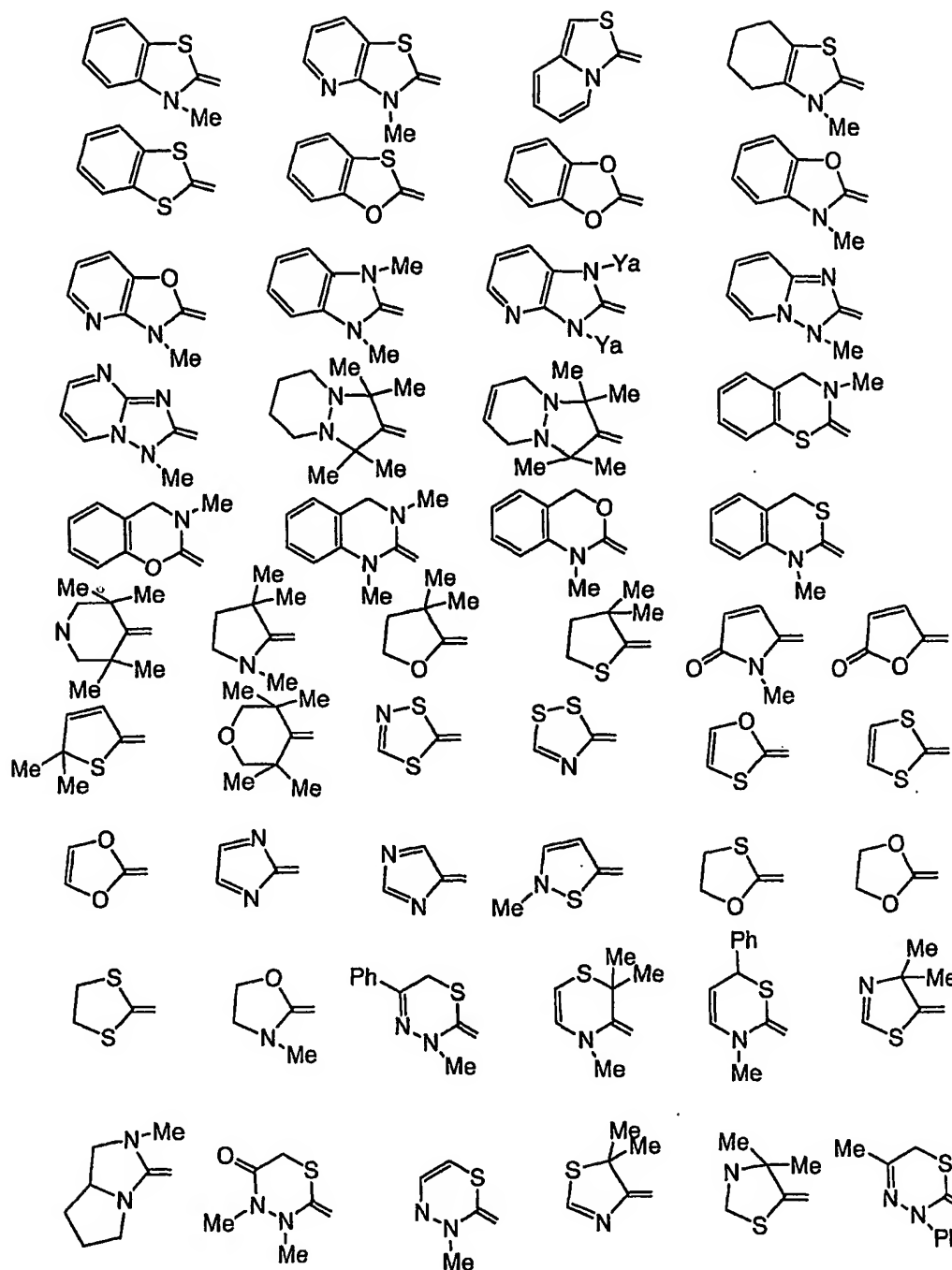
〔第 7 表〕





A





本発明化合物を植物病害および植物害虫防除剤として施用するにあたっては、
通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤

、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤および分解防止剤等を添加して、液剤 (soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wetttable powder)、水溶剤 (water soluble powder)、顆粒水和剤 (water dispersible granule)、顆粒水溶剤 (water soluble granule)、懸濁剤 (suspension concentrate)、乳濁剤 (concentrated emulsion)、サスポエマルジョン (suspoemulsion)、マイクロエマルジョン (microemulsion)、粉剤 (dustable powder)、粒剤 (granule) およびゲル剤 (gel) 等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ-ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸およびリン酸塩、

ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル４級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤１００重量部に対し、通常０．０５～２０重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても２種以上を併用してもよい。

また、本発明化合物を農薬として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と混合施用してもよい。

特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺菌殺虫スペクトラムの拡大や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック（Farm Chemicals Handbook）１９９９年版に記載されている化合物等がある。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみ限定されるものではない。

殺菌剤：アシベンゾラル（acibenzolar）、アムプロピルホス（ampropyfos）、アニラジン（anilazine）、アザコナゾール（azaconazole）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、ベナラキシル（benalaxyl）、ベノダニル（benodanil）、ベノミル（benomyl）、ベンザマクリル（benzamacril）、ビナバクリル（binapacryl）、ビフェニル（biphenyl）、ビテルタノール（bitertanol）、ベトキサジン（bethoxazine）、ボルドー液（bordeaux mixture）、ブラストサイジン-S（blasticidin-S）、プロモコナゾール（bromoconazole）、

ブピリメート（bupirimate）、ブチオベート（buthiobate）、カルシウムポリスルフィド（calcium polysulfide）、キャプタフォル（captafol）、キャプタン（captan）、銅パーオキシクロリド（copper oxychloride）、カルプロパミド（carpropamid）、カルベンダジン（carbendazim）、カルボキシシン（carbox

in)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロベンチアゾン(chlobenthiaz one)、クロルフェナゾール(chlorfenazol)、クロロネブ(chloroneb)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロゾリネート(chlozolate)、クフラネブ(cufraneb)、

シモキサニル(cymoxanil)、シプロコナゾール(cyproconazol)、シプロジニル(cyprodinil)、シプロフラム(cyprofuram)、デバカルブ(debacarb)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロフラニド(diclhlofluanid)、ジクロメジン(diclomedeine)、ジクロラン(dicloran)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、ジクロシメット(diclo cymet)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジフルメトリン(diflumeto rim)、ジメチリモール(dimethirimol)、

ジメトモルフ(dimethomorph)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、ジノカップ(dinocap)、ジフェニルアミン(di phenylamine)、ジピリチオン(dipyrrithione)、ジタリムホス(ditalimfos)、ジチアノン(dithianon)、ドデモルフ(dodemorph)、ドジン(dodine)、ドラゾクソロン(drazoxolon)、エデフェノホス(edifenphos)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、エタコナゾール(etaconazole)、エチリモル(ethiri mol)、エトリジアゾール(etridiazole)、ファモキサドン(famoxadone)、フェナリモル(fenarimol)、フェブコナゾール(febuconazole)、フェンフラム(fenfuram)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenprop idin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチン(fentin)、フェルバン(ferbam)、フェリムゾン(ferimzone)、フルアジナム(fluzinam)、フルジオキシニル(fludioxonil)、フルオロイミド(fluoroimide)、フルキンコナゾール(flusilazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルスルフアミド(flusulfamide)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアフォール(flutriafol)、フォルベット(folpet)、フォセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminium)、フベリダゾール(fuberidazole)、フララキシル(furalaxyl)、フェナミドン(fenamidone)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、

グアザチン(guazatine)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)、ヘ

キサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾール (hymexazol)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン (imin octadine)、イブコナゾール (ipconazole)、イプロベンホス (iprobenfos)、イプロジオン (iprodione)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシムーメチル (kresoxim-methyl)、マンカップパー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メパニピリム (mepanipirim)、メプロニル (mepromil)、メトラキシル (metalaxyl)、メトコナゾール (metconazole)、メチラム (metiram)、メトミノストロビン (metominostrobin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ナバム (nabam)、ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarbamate))、ニトロタールーイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモル (nuarimol)、オクチリノン (octhilinone)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、オキボコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、ペフラゾエート (pefurzoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、フタライド (phthalide)、ピペラリン (piperalin)、ポリオキシ (polyoxins)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキュロン (pyroquilon)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン (quintozene)、硫黄 (sulfur)、スピロキサミン (spiroxamine)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクナゼン (tecnazene)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チフルザミド (thiifluzamide)、チオファネートーメチル (thiophanate-methyl)、チラム (thiram)、トルクロホスーメチル (tolclofos-methyl)、トリルフラニド (tolylfluanid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (toriadimenol)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン

(triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ピンクロゾリン (vinclozolin)、ジネブ (zineb) 及びジラム (ziram) 等。

殺バクテリア剤：ストレプトマイシン (streptomycin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 及びオキシソリニックアシド (oxolinic acid) 等。

殺線虫剤：アルドキシカルブ (aldoxycarb)、フォスチアゼート (fosthiazate)、フォスチエタン (fosthietan)、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミホス (fenamiphos) 等。

殺ダニ剤：アミトラズ (amitraz)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロロベンジラート (chlorobezilate)、クロフェンテジン (clofentezine)、サイヘキサチン (cyhexatine)、ジコフォル (dicofol)、ジエノクロール (dienochlor)、エトキサゾール (etoxazole)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンプロキシメート (fenproximate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベメクチン (milbemectin)、プロパルギット (propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (pyrimidifen) 及びテブフェンピラド (tebufenpyrad) 等。

殺虫剤：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミピリド (acetamipirid)、アジンホスーメチル (azinphos-methyl)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタップ (bensultap)、ビフェントリン (bifenthrin)、ブプロフェジン (buprofezin)、ブトカルボキシシン (butocarboxim)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロチアニジン (clothianidin)、クロマフェノジド (chromafenozide)、クロピリホスーメチル (chlorpyrifos-methyl)、サイフルトリン (cyfluthrin)、ベーターサイフルトリン (beta-cyfluthrin)、サイパーメスリン (cypermethrin)

)、シロマジン (cyromazine)、サイハロトリン (cyhalothrin)、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ダイアジノン (diazinon)、ジアクロデン (diacioden)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフोटン (disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、EPN、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトリムホス (etrimfos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フルサイスリネート (flucythrinate)、フルフェノクスウロン (flufenoxuron)、フルフェンプロックス (flufenprox)、タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonophos)、フォルメタネート (formetanate)、フォルモチオン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocarb)、ハロフェノジド (halofenozide)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イソフェンホス (isofenphos)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、イソキサチオン (isoxathion)、ルフエヌウロン (lufenuron)、マラチオン (malathion)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メタクリホス (methacriphos)、メタルカルブ (metacarb)、メソミル (methomyl)、メソプレネ (methoprene)、メトキシクロール (methoxychlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、モノクロトホス (monocrotophos)、ムスカルーレ (muscalure)、ニテンピラム (nitenpyram)、オメトエート (omethoate)、オキシデメトン-メチル (oxydemeton-methyl)、オキサミル (oxamyl)、パラチオン (parathion)、パラチオン-メチル (parathion-methyl)、パーメスリン (permethrin)、フェントエート (phenthoate)、フォキシム (phoxim)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミホス-メチル (pirimiphos-

methy1)、プロフェノホス (profenofos)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofos)、シラフルオフエン (silafluofen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ (sulfotep)、テブフェノジド (tebfenozide)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthorin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、チオジカルブ (thiodicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チオフアノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トラロメスリン (tralomethrin)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリアズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン (vamidothion) 等。

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり 0.005 ~ 50 kg 程度が適当である。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔水和剤〕

| | |
|--------|------------|
| 本発明化合物 | 0.1 ~ 80 部 |
| 固体担体 | 5 ~ 98.9 部 |
| 界面活性剤 | 1 ~ 10 部 |
| その他 | 0 ~ 5 部 |

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

〔乳 剤〕

| | |
|--------|------------|
| 本発明化合物 | 0.1 ~ 30 部 |
| 液体担体 | 45 ~ 95 部 |
| 界面活性剤 | 4.9 ~ 15 部 |
| その他 | 0 ~ 10 部 |

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔懸濁剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.1～70部 |
| 液体担体 | 15～98.89部 |
| 界面活性剤 | 1～12部 |
| その他 | 0.01～30部 |

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

| | |
|--------|---------|
| 本発明化合物 | 0.1～90部 |
| 固体担体 | 0～98.9部 |
| 界面活性剤 | 1～20部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～70部 |
| 液体担体 | 20～99.99部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～80部 |
| 固体担体 | 10～99.99部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～30部 |
| 固体担体 | 65～99.99部 |
| その他 | 0～5部 |

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤を水で1～10000倍に希釈してまたは希釈せずに散布する。

次に、本発明化合物を有効成分とする農園芸用殺菌殺虫剤の製剤例を具体的に示すが、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

〔製剤例１〕 乳剤

| | |
|----------------|-----|
| 本発明化合物 No. I-1 | 20部 |
| メチルナフタレン | 55部 |
| シクロヘキサノン | 20部 |
| ソルポール 2680 | 5部 |

（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

以下を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

〔製剤例２〕 水和剤

| | |
|-----------------|-----|
| 本発明化合物 No. I-37 | 25部 |
| パイロフィライト | 66部 |
| ソルポール 5039 | 4部 |

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

| | |
|--------------|----|
| カープレックス #80D | 3部 |
|--------------|----|

（ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名）

| | |
|----------------|----|
| リグニンスルホン酸カルシウム | 2部 |
|----------------|----|

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

使用に際しては上記水和剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

〔製剤例３〕 粉剤

| | |
|------------------------|------|
| 本発明化合物 No. I-43 | 3部 |
| カープレックス #80D | 0.5部 |
| （ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名） | |
| カオリナイト | 95部 |

リン酸ジイソプロピル 1. 5 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。使用に際して上記粉剤を有効成分量がヘクタール当たり 0. 0 0 5 ~ 5 0 k g になるように散布する。

〔製剤例 4〕 粒剤

本発明化合物 No. I-53 5 部
ベントナイト 3 0 部
タルク 6 4 部
リグニンスルホン酸カルシウム 1 部

以上を均一に混合粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクタール当たり 0. 0 0 5 ~ 5 0 k g になるように散布する。

〔製剤例 5〕 懸濁剤

本発明化合物 No. I-70 2 5 部
ソルボール 3 3 5 3 5 部
(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業(株) 商品名)
ルノックス 1 0 0 0 C 0. 5 部
(陰イオン界面活性剤：東邦化学工業(株) 商品名)
ゼンサンガム(天然高分子) 0. 2 部
安息香酸ソーダ 0. 4 部
プロピレングリコール 1 0 部
水 5 8. 9 部

有効成分(本発明化合物)を除く上記の成分を均一に溶解し、ついで本発明化合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。使用に際しては、上記フロアブル剤を 5 0 ~ 2 0 0 0 0 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0. 0 0 5 ~ 5 0 k g になるように散布する。

〔製剤例 6〕 粒状水和剤

本発明化合物 No. II-1 7 5 部
ハイテノール NE-1 5 5 部
(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株) 商品名)

バニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株)商品名)

カーブレックス#80D 10部

(ホワイトカーボン：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合微粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。使用に際しては水で50～20000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

本発明化合物の施用方法としては、茎葉散布、土壌処理、種子消毒等が挙げられるが、通常当業者が利用する一般的な方法においても有効である。

本発明化合物の合成例を実施例として以下に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

本発明化合物の合成例を実施例として以下に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

〔実施例1〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物I-1)の合成

メチル 2-(2-(メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 4.76g(20mmol)を23mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これにフェナシルブロマイド 3.98g(20mmol)を加えた。115℃で3時間加熱攪拌した後、反応混合物に水50mlおよび1規定水酸化ナトリウム水溶液25mlを加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 6.6gを無色油状物として得た。

屈折率； $n_D^{21.5}$ 1.5600

〔実施例2〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニ

リデン) メチル) フェニル) - 3-メトキシ-2-プロペン酸 (本発明化合物I-37) および (本発明化合物I-38) の合成

55%水素化ナトリウム0.61g (14mmol) を10mlのN, N-ジメチルホルムアミドに懸濁し、これにメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸2g (6mmol) およびギ酸メチル3.6g (60mmol) を40mlのN, N-ジメチルホルムアミドに溶解したものを室温で加え、12時間攪拌した。この混合物に無水炭酸カリウム8.28g (60mmol) を加え、次いでジメチル硫酸1.51g (12mmol) を滴下した。室温にて、さらに3時間攪拌した後、反応混合物に水150mlを加え、酢酸エチルにて抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル=1:1) にて精製することにより、低極性成分として、E体のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) - 3-メトキシ-2-プロペン酸0.84gおよび高極性成分として、Z体のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) - 3-メトキシ-2-プロペン酸0.24gをそれぞれ無色結晶として得た。

E体 融点; 118-120℃

Z体 融点; 141-143℃

[実施例3]

メチル 2-(2-(アザ(5-(ジメチルアミノ)-4-フェニル(2, 5-チアゾリニデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物III-11) の合成

1, 1-ジメチルヒドラジン0.44g (7.4mmol) を100mlのテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸1.53g (7.4mmol) を加えた。室温にて1時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-((((ジメチルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸1.43gを無色結晶として得た。

融点；130－131℃

引き続き、得られたメチル 2－（2－（（（ジメチルアミノ）アミノ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸 1.2 g（4.5 mmol）をN，N－ジメチルホルムアミド 5 ml に溶解し、これにフェナシルプロマイド 0.9 g（4.5 mmol）を加えた。室温にて1時間攪拌した後、反応混合物に水 20 ml および1規定水酸化ナトリウム水溶液 5 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2－（2－（アザ（5－（ジメチルアミノ）－4－フェニル（2，5－チアゾリニデン））メチル）フェニル）酢酸 1.1 g を無色結晶として得た。

融点；88－89℃

〔実施例4〕

メチル 2－（2－（アザ（6－フェニル（2，6－チアザパーヒドロイニリデン））メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物X-1）の合成

N－フェニル－N－アリルアミン 0.27 g（2 mmol）を 2 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2－（2－イソチオシアネートフェニル）酢酸 0.41 g（2 mmol）を加えた。室温にて16時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄することによりメチル 2－（2－（（フェニル－2－プロベニルアミノ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸 0.5 g を無色結晶として得た。

融点；72－73℃

引き続き得られた、メチル 2－（2－（（フェニル－2－プロベニルアミノ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸 0.4 g（1.2 mmol）をトリフルオロ酢酸 2 ml に溶解し、室温にて16時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、目的のメチル 2－（2－（アザ（6－フェニル（2，6－チアザパーヒドロイニリデン））メチル）フェニル）酢酸 0.33 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率； n_{D21} 1.5728

〔実施例5〕

メチル 2- (2- (アザ (5-メチル-3-メチレン (2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 IX-1) の合成

N-メチル-N-プロパルギルアミン 1.52 g (22 mmol) を 200 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2- (2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 4.14 g (20 mmol) を加えた。室温にて 2 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、メチル 2- (2- ((メチル-2-プロピニルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 4.3 g を無色結晶として得た。

融点; 83-84℃

引き続き得られた、メチル 2- (2- ((メチル-2-プロピニルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸を室温にて、2 週間放置することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (5-メチル-3-メチレン (2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸を淡黄色油状物として得た。

屈折率; $n_D^{21.0}$ 1.5078

[実施例 6]

メチル 2- (2- (アザ (5-メチル-3- (プロモメチル) -2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 臭化水素酸塩 (本発明化合物 I-202) の合成

実施例 5 で得られた、メチル 2- (2- ((メチル-2-プロピニルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 2.7 g (10 mmol) をクロロホルム 50 ml に溶解し、臭素 1.6 g (10 mmol) を加えた。これを室温にて一時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルにて洗浄することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (5-メチル-3- (プロモメチル) -2, 5-チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 臭化水素酸塩 2.6 g を無色結晶として得た。

融点; 180-183℃

[実施例 7]

メチル 2- (2- (アザ (5-メチル-3- (プロモメチル) -2, 5-チアゾリジニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 臭化水素酸塩 (本発明化合物 IX-1

3) の合成

N-メチル-N-アリルアミン 1.56 g (22 mmol) を 200 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 4.14 g (20 mmol) を加えた。室温にて 2 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-(メチル-2-プロペニルアミノ)チオキシメチル)アミノ)フェニル)酢酸 3.9 g を無色結晶として得た。

融点; 46-47℃

引き続き得られた、メチル 2-(2-(メチル-2-プロペニルアミノ)チオキシメチル)アミノ)フェニル)酢酸 3.5 g (12.6 mmol) をクロロホルム 130 ml に溶解し、臭素 2 g (12.6 mmol) を加えた。これを室温にて 3 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をジエチルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-(ブromoメチル)-2,5-チアゾリジニリデン)メチル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 5.4 g を無色結晶として得た。

融点; 177-179℃

〔実施例 8〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-(トリフルオロメチル)(2,5-チアゾリニリデン))メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物 I-29) の合成
メチル 2-(2-(メチルアミノ)チオキシメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.5 g (6.3 mmol) および 3-ブromo-1,1,1-トリフルオロ-2-プロパノン 1.2 g (6.3 mmol) の N,N-ジメチルホルムアミド 5 ml 溶液を室温で 2 時間攪拌した。反応液に水および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジクロロメタン 30 ml に溶解し、ピリジン 3.13 g (39.6 mmol) を加え、そこにトリフルオロ酢酸無水物 1.67 g (8.0 mmol) を滴下し、室温で 1 時間攪拌した。析出した塩をろ過により取り除いた後、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸

エチル＝２：１）にて精製することにより目的のメチル ２－（２－（アザ（５－メチル－４－（トリフルオロメチル）（２，５－チアゾリニリデン））メチル）フェニル）酢酸 １．８ｇを無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.5}$ １．５５２８

〔実施例 ９〕

メチル ２－（２－（アザ（３－メチル－３－ヒドロベンゾチアゾール－２－イリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物 XI-1）の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート ０．４５ｇ（３．０３ mmol）を １５ ml の １，２－ジクロロエタン中に懸濁させ、これに ２－クロロベンゾチアゾール ０．５１ｇ（３．０３ mmol）を加えた。この混合物を ６０℃で １．５時間加熱撹拌した後、室温まで冷却し、さらに ２ ml の １，２－ジクロロエタンに溶解したメチル ２－（２－アミノフェニル）酢酸 ０．５ｇ（３．０３ mmol）を加え、室温にて ２時間撹拌した。反応混合物に ５０ ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、１，２－ジクロロエタンにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（アセトニトリル：水＝４：１）、引き続き分取薄層クロマトグラフィー（クロロホルム）にて精製することによりメチル ２－（２－（アザ（３－メチル－３－ヒドロベンゾチアゾール－２－イリデン）メチル）フェニル）酢酸 ０．５２ｇを無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.5}$ １．５５１２

〔実施例 １０〕

メチル ２－（２－（アザベンゾ〔c〕１，３－ジチオレン－２－イリデンメチル）フェニル）酢酸（本発明化合物 XI-3）の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート ０．４５ｇ（３．０３ mmol）を １５ ml の １，２－ジクロロエタン中に懸濁させ、これに １，３－ベンゾジチオール－２－チオン ０．５６ｇ（３．０３ mmol）を加えた。この混合物を ６０℃で ３０分間加熱撹拌した後、室温まで冷却し、さらに ２ ml の １，２－ジクロロエタンに溶解したメチル ２－（２－アミノフェニル）酢酸 ０．５ｇ（３．０３ mmol）を加え、室温にて ２．５時間撹拌した。反応混合物に ５０ ml

1 の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（アセトニトリル：水＝4：1）にて精製することによりメチル 2-（2-（アザベンゾ[c]2,5-ジチオレン-2-イリデンメチル）フェニル）酢酸 0.1 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率； $n_D^{21.41}$ 1.5032

〔実施例 11〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（4-プロモフェニル）（2,5-ジチオレニリデン））メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物II-25）の合成

トリエチルアンモニウム 2-（2-メトキシ-2-オキソエチル）フェニルカルバモジチオエート 2.04 g（5.96 mmol）を 30 ml のクロロホルムに溶解し、これに 2 ml のクロロホルムに溶解させたトリエチルアミン 0.13 g（1.28 mmol）を加え、引き続き、2-プロモ-1-（4-プロモフェニル）エタノン 1.74 g（6.26 mmol）を加えた。室温で 4 時間撹拌した後、反応混合物を 1 規定塩酸にそそぎ入れクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝1：2）にて精製することにより、メチル 2-（2-（（2-オキソ-2-（4-プロモフェニル）エチルチオ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸を 1.53 g を得た。

引き続き、得られたメチル 2-（2-（（2-オキソ-2-（4-プロモフェニル）エチルチオ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸を 1.53 g（3.49 mmol）を 15 ml の硫酸に溶解した。室温で 1 時間撹拌した後、反応混合物を氷水にそそぎ入れ酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝1：3）にて精製し、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（4-プロモフェニル）（2,5-ジチオレニリデン））メチル）フェニル）酢酸 0.4 g を無色結晶として得た。

融点；109-112℃

〔実施例12〕

メチル 2- (2- ((1, 3-ジメチル-4-オキソ-2-イミダゾリジニリデン) アミノ) フェニル) 酢酸 (本発明化合物IX-8) の合成

サルコシンエチルエステル塩酸塩 0.6 g (4 mmol) をクロロホルム 15 ml に懸濁させ、そこに室温でトリエチルアミン 1.0 g (10 mmol) を滴下した。この懸濁混合溶液を氷冷し、メチル 2- (2- ((メチルイミノ) メチレン) アミノ) フェニル) 酢酸 0.8 g (4 mmol) のクロロホルム (5 ml) 溶液を滴下した。反応液を室温に戻し、さらに3時間攪拌した。その後反応液を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3：2) にて精製した後、ジイソプロピルエーテルにて結晶化することにより目的のメチル 2- (2- ((1, 3-ジメチル-4-オキソ-2-イミダゾリジニリデン) アミノ) フェニル) 酢酸 0.4 g を無色結晶として得た。

融点；57-59℃

〔実施例13〕

メチル 2- (2- ((6-メチル-3-フェニル (3H-2, 6-チアジニリデン) アミノ) フェニル) 酢酸 (本発明化合物X-3) の合成

メチル 2- (2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 2.86 g (13.8 mmol)、およびN- (3-フェニル-2-プロベニリデン) メタンアミン 2 g (13.8 mmol) をベンゼン 30 ml に溶解し、加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温に戻し、溶媒を減圧留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1) にて精製することにより目的のメチル 2- (2- ((6-メチル-3-フェニル (3H-2, 6-チアジニリデン) アミノ) フェニル) 酢酸 2.2 g を無色油状物として得た。

屈折率； n_D^{21} 1.6292

〔実施例14〕

メチル 2- (2- (アザ (3-フェニル (2, 5-オキサチオラニリデン)

メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 IX-14) の合成

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 0.3 g (0.8 mmol) をキシレン 10 ml に溶解し、加熱還流下で 1 時間攪拌した。反応終了後、室温に戻し、減圧下で溶媒を留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 2: 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-フェニル(2, 5-オキサチオラニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 0.2 g を得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm))

3.38 (dd, $J=9.1, 11.0\text{Hz}$, 1H), 3.60-3.65 (m, 1H), 3.65 (s, 3H),

3.66 (s, 2H), 5.63 (dd, $J=5.8, 9.1\text{Hz}$, 1H), 6.96-7.46 (m, 9H)

〔実施例 15〕

メチル 2-(2-(アザ(6-メチル-4-フェニル(3H-2, 5, 6-チアアジアジニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 X-2) の合成

メチルヒドラジン 0.34 g (7.4 mmol) を 100 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 1.53 g (7.4 mmol) を加えた。室温にて 1 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-((アミノメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 1.4 g を無色結晶として得た。

融点; 149-150°C

引き続き得られた、メチル 2-(2-((アミノメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 1.1 g (4.3 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml に溶解し、これにフェナシルプロマイド 0.87 g (4.3 mmol) を加えた。室温にて 2 時間攪拌した後、反応混合物に水 20 ml および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 5 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(6-メチル-4-フェニル(3H-2, 5, 6-チアアジアジニリデ

ン) メチル) フェニル) 酢酸 1.4 g を無色結晶として得た。

融点; 85 – 86 °C

〔実施例 16〕

メチル 2 – (2 – (アザ (5 – メチル – 3 – フェニル (2, 4, 5 – チアジ
アゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 IX-10) の合成

実施例 15 により得られた、メチル 2 – (2 – ((アミノメチルアミノ)
チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 8 g (31.6 mmol) をピリジン
20 ml に溶解し、混合物を 0 °C まで冷却した後、ベンゾイルクロライド 4.4
g (31.6 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに室温
にて 2 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に水 50 ml およ
び 1 規定塩酸を加え pH = 3 とした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫
酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジ
イソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2 – (2 – ((メチル
(フェニルカルボニルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢
酸 8.1 g を無色結晶として得た。

融点; 148 – 150 °C

引き続き得られた、メチル 2 – (2 – ((メチル (フェニルカルボニルア
ミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 5.36 g (15.4
mmol) を濃硫酸 25 ml に少量ずつ加えた。室温にて 2 時間攪拌後、氷水 2
0 ml に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾
燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテル
にて洗浄することにより目的のメチル 2 – (2 – (アザ (5 – メチル – 3 – フ
ェニル (2, 4, 5 – チアジアゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 3 g を
無色結晶として得た。

融点; 76 – 77 °C

〔実施例 17〕

メチル 2 – (2 – (アザ (5 – メチル – 3 – フェニル (2, 4, 5 – オキサ
ジアゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 IX-9) の合成

実施例 16 により得られた、メチル 2 – (2 – ((メチル (フェニルカル

ボニルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 3.8 g (10.6 mmol) をアセトンに溶解した。次いで、1 規定炭酸カリウム水溶液 35 ml およびヨウ化エチル 2 ml を加え、60℃にて2時間攪拌後、減圧下溶媒を留去した。残渣に水 20 ml を加え析出した結晶を濾取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後濾過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-フェニル(2,4,5-オキサジアゾリニリデン))メチル)フェニル)酢酸 2.4 g を無色結晶として得た。

融点; 97-99℃

[実施例 18]

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(ジメチルアミノ)-2-(2-(2-クロロフェニル)-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸(化合物XI I-14)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 0.4 g (1.59 mmol) を 12 ml の 1,4-ジオキサンに溶解し、これに 2-クロロフェナシルプロマイド 0.37 g (1.59 mmol) を加えた。室温で6時間攪拌した後、析出した結晶をろ取し、ジエチルエーテルで洗浄を行った。得られた結晶を1規定水酸化ナトリウム水溶液 10 ml に溶解し、酢酸エチルにて抽出を行った。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル 2-(2-(1-アザ-2-(ジメチルアミノ)-2-(2-(2-クロロフェニル)-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 0.38 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.5} 1.5364$

[実施例 19]

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-メトキシフェニル)(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物II-5)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 1 g (3.96 mmol) を 20 ml の 1,4-ジオキサンに溶解し、これに 2-メトキシフェナシルプロマイド 0.91 g (3.96 mmol) を加

えた。20時間加熱還流を行った後、減圧下1,4-ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を1規定水酸化ナトリウム水溶液10mlに溶解し、酢酸エチルにて抽出を行った後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝1：4）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（2-メトキシフェニル）（2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸0.9gを無色油状物として得た。

屈折率； n_D^{21} 1.5262

〔実施例20〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（2-メチルプロピル）（2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物II-20）の合成

メチル 2-（2-イソチオシアネートフェニル）酢酸1.04g（5mmol）およびイミダゾール3g（44mmol）をジオキサン30mlに溶解し、1-ブロモ-4-メチル-2-ペンタノン1.8g（10mmol）を加えて、室温で30分撹拌した。この反応液にさらに0.9g（5mmol）の、1-ブロモ-4-メチル-2-ペンタノンを加え、30分撹拌する操作を2回行った。その後、反応液を加熱還流下で3時間撹拌した後、室温に戻し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣に1規定水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣を2回のシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル＝4：1、クロロホルム）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（2-メチルプロピル）（2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸0.3gを無色油状物として得た。

屈折率； n_D^{21} 1.5630

〔実施例21〕

メチル 2-（2-（アザ（2-メチル-3,5-ジメトキシ-2,6-ピリミジニリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物X-4）の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート0.45g（3.03mmol）

1) を 15 ml の 1, 2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 2-クロロ-4, 6-ジメトキシピリミジン 0.53 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60℃ で 1 時間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 2.5 時間攪拌した。反応混合物に 50 ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル：水 = 4 : 1) にて精製することにより、メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3, 5-ジメトキシ-2, 6-ピリジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 60 mg を無色結晶として得た。

融点 ; 122-123℃

〔実施例 22〕

メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3-フルオロ-2-ピリジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 (本発明化合物 X-5) の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート 0.45 g (3.03 mmol) を 15 ml の 1, 2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 2, 6-ジフルオロピリジン 0.35 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60℃ で 2 時間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 6 日間攪拌した。反応混合物に 50 ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル：水 = 4 : 1) にて精製することにより、メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3-フルオロ-2-ピリジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 80 mg を橙色油状物として得た。

屈折率 ; $n_D^{21.7} 1.5286$

〔実施例 23〕

メチル 2-(2-(アザ(6-メチル-5-フェニル(2H-3, 6-チア

ジニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物X-9) の合成

チオグリコール酸アミド 10 g (0.11 mol) およびトリエチルアミン 11.2 g (0.11 mol) をメチルエチルケトン (100 ml) に懸濁させ、氷冷下フェナシルプロマイド 22 g (0.11 mol) を加え、反応液を 7 時間加熱還流させた。室温まで放冷した後溶媒を減圧留去し、水を加えた。酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。ジイソプロピルエーテルおよびジエチルエーテルの混合溶液から結晶化させ、減圧ろ過、乾燥することによりフェナシルチオ酢酸アミド 20.6 g (0.1 mol) を得た。

融点: 106-107°C

得られた、フェナシルチオ酢酸アミド 20.4 g (0.1 mol) のトルエン 80 ml の懸濁溶液に触媒量の p-トルエンスルホン酸を加え、脱水しながら 60 時間加熱還流した。室温まで放冷した後、析出した結晶をトルエンおよびジエチルエーテルにて洗浄し、減圧乾燥することにより 5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-オン 17.4 g (91 mmol) を得た。

融点: 150-155°C

引き続き得られた、5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-オン 13 g (68 mmol) を 300 ml のアセトニトリルに溶解し、炭酸カリウム 14.1 g (138 mmol) およびヨウ化メチル 38.7 g (273 mmol) を加え、30 時間加熱還流した。反応混合物を冷却し、生成した沈殿を濾去し、濾液を濃縮乾固した。得られた残さをクロロホルムと水とに分配し、有機層を濃縮して得られるシラップをジイソプロピルエーテルから結晶化した。濾取した後、減圧乾燥させることにより、4-メチル-5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-オン 8 g (39 mmol) を得た。

融点: 95-97°C

引き続き得られた、4-メチル-5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-オン 2.7 g (13.2 mmol) を 50 ml の 1,4-ジオキサンに溶解させ、そこにローソン試薬 (Lawesson's Reagent) 3.9 g (9.6 mmol) を加え、70°C で 5 時間攪拌した。室温まで放冷し、

不溶物を濾去し、溶媒を減圧留去した。得られた残さを少量のエタノールから結晶化した。濾取した後、減圧乾燥させることにより4-メチル-5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-チオン2.3g(10.4mmol)を得た。

融点；83-85℃

引き続き得られた、4-メチル-5-フェニル-2H-1,4-チアジン-3(4H)-チオン2g(9mmol)をアセトン(20ml)に溶解し、ヨウ化メチル4g(28mmol)を加えて9時間加熱還流した。室温まで放冷し析出している沈殿物を濾取し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、減圧乾燥することにより4-メチル-3-メチルチオ-5-フェニル-2H-1,4-チアジニウム ヨージド2.4g(6.6mmol)を得た。

融点；140-145℃(分解)

引き続きメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸0.34g(2.1mmol)を10mlの1,2-ジクロロエタンに溶解させ、得られた4-メチル-3-メチルチオ-5-フェニル-2H-1,4-チアジニウム ヨージド0.5g(1.4mmol)を加えて、室温で3時間攪拌した。反応終了後、1規定の水酸化ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(6-メチル-5-フェニル(2H-3,6-チアジニリデン))メチル)フェニル)酢酸0.36g(1mmol)を得た。

屈折率； $n_{D20.4}$ 1.6251

〔実施例24〕

メチル 2-(2-(アザ(4-(アザフェニルメチレン)-5-メチル(2,5-チアゾリジニリデン))メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物IX-16)の合成

アニリン1.40g(15.0mmol)を40mlのテトラヒドロフランに溶解し、これにプロモアセチルクロライド2.50g(15.9mmol)を1

ml のテトラヒドロフランに溶解したもののおよびトリエチルアミン 1.72 g (17.0 mmol) を 2 ml のテトラヒドロフランに溶解したものを室温に加え、4 時間攪拌した。反応混合物を 1 規定の塩酸にそそぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1 規定の水酸化ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去し、2-ブロモ-N-フェニルアセトアミド 3.01 g を得た。

得られた、2-ブロモ-N-フェニルアセトアミド 1.59 g (7.43 mmol) を 30 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-(メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.61 g (6.76 mmol) を室温に加え 4 時間 30 分攪拌した。反応中に析出した塩をろ取することにより、メチル 2-(2-(1-アザ-2-(メチルアミノ)-2-(2-アニリノ-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 2.62 g を得た。

引き続き得られたメチル 2-(2-(1-アザ-2-(メチルアミノ)-2-(2-アニリノ-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 2.62 g (5.79 mmol) を 30 ml の 1,2-ジクロロエタンに溶解し、これにトリエチルアミン 0.66 g (6.52 mmol) を 1 ml の 1,2-ジクロロエタンに溶解したもの、四塩化炭素 2.00 g (13 mmol) を 1 ml の 1,2-ジクロロエタンに溶解したもののおよびトリフェニルホスフィン 3.66 g (12.8 mmol) を室温にて加え、24 時間攪拌した。この反応混合物に水を加えクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(4-(アザフェニルメチレン)-5-メチル(2,5-チアゾリジンニリデン))メチル)フェニル)酢酸 0.10 g を得た。

屈折率; $n_{D_{20}} 1.5326$

[実施例 25]

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-tert-ブチルフェニル)-4-クロロ-

2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 II-425) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル) 酢酸 0.64 g (2.55 mmol) を 20 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(4-tert-ブチルフェニル)-1-エタノン 0.65 g (2.55 mmol) を加えた。120℃にて2時間攪拌を行った後、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (アセトニトリル: 水 = 4 : 1) にて精製することによりメチル 2-(2-(アザ(3-(4-tert-ブチルフェニル)(2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 0.22 g を無色油状物として得た。

得られたメチル 2-(2-(アザ(3-(4-tert-ブチルフェニル)(2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 0.21 g (0.55 mmol) を 20 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解し、これに N-クロロコハク酸イミド 0.07 g (0.55 mmol) および触媒量のアゾビスイソブチロニトリルを加えた。還流下 20 時間攪拌を行った後、得られた反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-tert-ブチルフェニル)-4-クロロ-(2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 0.20 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D20.7}$ 1.5306

[実施例 26]

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-クロロフェニル)-4-メチルメルカプト-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 (本発明化合物 II-404) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル) 酢酸 0.99 g (3.93 mmol) を 10 ml の N, N-ジメチルホルム

アミドに溶解し、これに2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノン1.1g(3.93mmol)を加えた。120℃にて2時間撹拌を行った後、水50mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(アセトニトリル：水=4：1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-クロロフェニル)-4-メチルメルカプト-(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸1.05gを無色油状物として得た。

屈折率； $n_D^{21.5}$ 1.5336

〔実施例27〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物II-307)の合成

メチル 2-(2-(ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸0.68g(3mmol)を20mlの1,4-ジオキサンに溶解し、これに2-ブロモ-1-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.1g(3.93mmol)を加えた。120℃にて2.5時間撹拌を行った後、減圧下溶媒を留去し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液50mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(アセトニトリル：水=4：1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.57gを無色油状物として得た。

屈折率； $n_D^{21.5}$ 1.5418

〔実施例28〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-4-メトキ

シフェニル) 酢酸 (本発明化合物II-244) の合成

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-メトキシフェニル) 酢酸 0.282 g (1 mmol) を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1- (2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -1-プロパノン 0.3 g (1 mmol) を加えた。80℃にて5時間攪拌を行った後、水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル=3:1) にて精製することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (3- (2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -4-メチル- (2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) -4-メトキシフェニル) 酢酸 0.21 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D20.2}$ 1.3871

〔実施例 29〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) -6-メチルフェニル) 酢酸 (本発明化合物II-297) の合成

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -6-メチルフェニル) 酢酸 0.266 g (1 mmol) を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1- (2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -1-プロパノン 0.3 g (1 mmol) を加えた。80℃にて5時間攪拌を行った後、水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (3- (2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -4-メチル- (2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) -6-メチルフェニル) 酢酸 0.1 g を無色結晶として得た。

融点: 88-89℃

〔実施例 30〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物VII-1) の合成

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 0.894 g (3.55 mmol) を 7 ml の 1, 4-ジオキサンに溶解し、これに 2-ブロモ-1- (5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) -1-プロパノン 1 g (3.55 mmol) を加えた。2時間加熱還流を行った後、減圧下 1, 4-ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (酢酸エチル：ヘキサン=1：4) にて精製することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0.9 g を無色結晶として得た。

融点：64-67℃

〔実施例 31〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物VIII-1) の合成

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 1.2 g (4.76 mmol) を 5 ml の 1, 4-ジオキサンに溶解し、これに 2-ブロモ-1- (6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル) -1-プロパノン 1.39 g (4.93 mmol) を加えた。1時間加熱還流を行った後、減圧下 1, 4-ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (酢酸エチル：ヘキサン=3：7) にて精製することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (3- (6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 1.2 g を無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D24.2}$ 1.4715

〔実施例 32〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル

ル) 2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物VI I-2) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 1.41 g (5.6 mmol) を 15 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノン 1.5 g (5.6 mmol) を加えた。100℃にて4時間攪拌を行った後、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) 2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 1.22 g を無色結晶として得た。

融点: 97-99℃

〔実施例 33〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-クロロ-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物VII-11) の合成

実施例 32 で得られた、メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) 2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 1.22 g (3.09 mmol) を 20 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解し、これに N-クロロコハク酸イミド 0.45 g (3.4 mmol) および触媒量のアゾビスイソブチロニトリルを加えた。還流下 80 時間攪拌を行った後、得られた反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (アセトニトリル: 水 = 4: 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-クロロ-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0.16 g を無色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 3.64(s, 3H), 3.68(s, 2H), 7.02-8.04(m, 6H), 8.83(s, 1H)

〔実施例 34〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物IV-9) の合成

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 5.8 g (22.83 mmol) を 100 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1- (5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル) -1-プロパノン 10 g (5.6 mmol) を加えた。100℃にて4時間攪拌を行った後、水 50 ml を加え、析出した結晶をろ取することにより目的のメチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 4.8 g を無色結晶として得た。

融点: 95-96℃

〔実施例 35〕

メチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物IV-16) およびメチル 2- (2- (アザ (3- (3-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物V-10) の合成

実施例 34 にて得られた、メチル 2- (2- (アザ (3- (5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル) -4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0.41 g (1.03 mmol) をアセトニトリルに溶解し、次いで、クロロアセトニトリル 0.15 g (2.06 mmol) および炭酸カリウム 0.3 g (2.17 mmol) を加え、80℃にて8時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣

をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 0.17 g およびメチル 2-（2-（アザ（3-（3-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 0.25 g をそれぞれ無色油状物として得た。

メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸

屈折率； $n_{D22} = 1.4558$

メチル 2-（2-（アザ（3-（3-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸

屈折率； $n_{D22} = 1.4950$

〔実施例 36〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-5-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物V-1）の合成

メチル 2-（2-（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）フェニル）酢酸 0.668 g（2.65 mmol）を 10 ml の *N,N*-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-（3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-1-プロパノン 0.84 g（2.95 mmol）を加えた。100℃にて30分間攪拌を行った後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝2：3）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-5-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 0.5 g を無色油状物として得た。

屈折率； n_D^{21} 1.4868

〔実施例 37〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）-6-メチルフェニル）酢酸（本発明化合物 IV-3）の合成

メチル 2-（2-（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）-6-メチルフェニル）酢酸 0.4 g（1.5 mmol）を 3 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-1-プロパノン 0.71 g（1.5 mmol）を加えた。100℃にて 30 分間攪拌を行った後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝3：7）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）-6-メチルフェニル）酢酸 0.4 g を無色油状物として得た。

屈折率； n_D^{21} 1.5206

〔実施例 38〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）-6-メチルフェニル）酢酸（本発明化合物 VII-6）の合成

メチル 2-（2-（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）-6-メチルフェニル）酢酸 0.532 g（2 mmol）を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-（5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル）-1-プロパノン 0.564 g（2 mmol）を加えた。100℃にて 2 時間攪拌を行った後、反応混合物に水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝1：1）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル

) - 4 - メチル - 2, 5 - オキサチオレニリデン) メチル) - 6 - メチルフェニル) 酢酸 0.57 g を無色結晶として得た。

融点: 116 - 117 °C

〔実施例 39〕

メチル 2 - (2 - (アザ (3 - (5 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 4 - メチル - 2, 5 - オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 II-339) の合成

参考例 20 により得られた 2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸 4.25 g (13.8 mmol) をベンゼン 70 ml に溶解し、塩化チオニル 5.02 g (42.2 mmol) を加え、還流下 2.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣にテトラヒドロフラン 70 ml を加え、氷冷下 28% アンモニア水 4.31 g (70.9 mmol) を加え、室温にて 10 分間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸アミド 2.92 g を無色結晶として得た。

融点: 128 - 132 °C

引き続き 2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸アミド 2.01 g (6.56 mmol) をテトラヒドロフラン 40 ml に溶解し、次いで、ピリジン 2.61 g (33 mmol) およびトリフルオロ酢酸無水物 1.53 g (7.28 mmol) を加え室温にて 2.75 時間攪拌した。反応混合物に、酢酸エチルおよび水を加えた後、1 規定塩酸にて pH 2 に調整した。酢酸エチルにて抽出し水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより、2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - ニトリル 1.31 g を得た。

ヒドロキシルアミン塩酸塩 0.23 g (3.31 mmol) をメタノール 15 ml に溶解し、ナトリウムメトキシド 0.19 g (3.52 mmol) および 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-ニトリル 0.95 g (3.29 mmol) を加え室温にて、1.5 時間攪拌した。さらにヒドロキシルアミン塩酸塩 0.044 g (0.633 mmol) およびナトリウムメトキシド 0.036 g (0.666 mmol) を加え、引き続き 2.5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン 25 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸無水物 3.44 g (16.38 mmol) を加え、22.5 時間室温にて攪拌後、50℃にて 30 分間攪拌した。次いで、還流下 8 時間攪拌後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に、水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=5:1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.15 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D21} = 1.5318$

〔実施例 40〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(3-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物 II-405) の合成

参考例 20 により得られた 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸 1.43 g (4.65 mmol) をベンゼン 20 ml に溶解し、塩化チオニル 1.7 g (14.3 mmol) を加え、還流下 1.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をクロロホルム 10 ml に溶解し、氷冷下、ベンズアミジン 1.1 g (7.02 mmol), トリエチルアミン 1.42 g (14 mmol) およびクロロホルム 20 ml の混合物に加えた。室温にて

24時間攪拌後、減圧下溶媒を留去し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）にて精製することにより、2-（2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ）-〔1, 3〕オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸フェニルアミジド1.4gを得た。得られた2-（2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ）-〔1, 3〕オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸フェニルアミジド1.4gをメタノール30mlおよび水20mlに溶解し、次亜塩素酸ナトリウム水溶液（有効塩素濃度8%）4.24g（4.56mmol）および炭酸ナトリウム0.55g（5.19mmol）を加え室温にて、4時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を薄層シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=3：2）にて精製することにより、目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（3-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸0.18gを得た。

融点：140-143℃

〔実施例41〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（5-メチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物II-336）の合成

参考例20により得られた2-（2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ）-〔1, 3〕オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸4g（13mmol）をベンゼン200mlに溶解し、塩化チオニル3.88g（32.5mmol）を加え、還流下1.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣の半量を、アセトヒドラジド0.625g（8.45mmol）、トリエチルアミン1.313g（13mmol）および1, 2-ジクロロエタン30mlの混合物に加え、室温にて2時間攪拌した。減圧

下溶媒を留去し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をトルエン20mlに溶解し、次いで、ローソン試薬(Lawesson's Reagent) 1.5gを加え、還流下1.5時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)および薄層シリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-メチル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.7gを無色油状物として得た。

屈折率; n_D^{21} , 1.6528

[実施例42]

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物II-423)の合成

参考例20により得られた2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸7g(22.8mmol)をベンゼン300mlに溶解し、塩化チオニル6.78g(57mmol)およびN,N-ジメチルホルムアミド1滴を加え、還流下2時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、アセトニトリル100ml、塩化マグネシウム2.166g(22.8mmol)およびトリエチルアミン4.605g(45.6mmol)の混合物に加え、室温にて48時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、濃塩酸にてpHを2に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジメチルスルホキシド100mlに溶解し、水0.718g(39.9mmol)を加え、140℃にて5時間攪拌した。反応混合物に水100mlを加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて精製後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:

酢酸エチル＝５：２）にて精製することにより２－（２－メトキシカルボニルメチル－フェニルイミノ）－４－メチル－５－アセチル－〔１，３〕オキサチオール４ｇを得た。

屈折率； $n_D^{21.5}$ 1.5436

次いで、得られた２－（２－メトキシカルボニルメチル－フェニルイミノ）－４－メチル－５－アセチル－〔１，３〕オキサチオール 0.74 g (2.43 mmol) を４塩化炭素 15 ml に溶解し、トリメチルシリルクロリド 0.53 g (4.86 mmol) を加え、室温にて５分攪拌した後、臭素 0.582 g (3.64 mmol) を加えた。さらに室温にて１５時間攪拌後、減圧下溶媒を留去し、水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml に溶解し、ついで、トリフルオロアセトチオアミド 0.234 g (1.82 mmol) を加え、室温にて２時間攪拌した後、110℃にて３時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）にて精製することにより目的のメチル 2-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチルチアゾール-4-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 35 mg を無色結晶として得た。

融点：125－126℃

〔実施例 43〕

メチル 2-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシーチアゾリン-2-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸（本発明化合物 II-427）の合成

実施例 39 にて得られた 2-（2-メトキシカルボニルメチル－フェニルイミノ）－〔１，３〕オキサチオール－４－メチル－５－カルボン酸アミド 3.9 g (12.7 mmol) をトルエン 60 ml に溶解し、ついでローソン試薬（La

wesson's Reagent) 5.137 g (12.7 mmol) を加え、還流下 1.5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより 2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1, 3] オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸チオアミド 2.85 g を得た。次いで、得られた 2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1, 3] オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸チオアミド 1.2 g (3.73 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml に溶解し、次いで、1, 1, 1-トリフルオロ-3-プロモアセトン 0.711 g (3.73 mmol) を加え、室温にて 48 時間攪拌した。反応混合物に水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出後、酢酸エチル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル 2 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシチアゾリン-2-イル))-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 220 mg を無色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 2.46(s, 3H), 3.11(s, 1H), 3.50(m, 1H), 3.66(s, 3H), 3.66(s, 2H), 3.66(m, 1H), 6.98-7.31(m, 4H)

[実施例 44]

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルチアゾール-2-イル))-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物 II-428) の合成

実施例 43 にて得られた、メチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシチアゾリン-2-イル))-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 200 mg (0.46 mmol) をジクロロメタン 5 ml に溶解し、ピリジン 0.182 g (2.3 mmol) およびトリフルオロ酢酸無水物 0.194 g (0.92 mmol) を加え、還流下 2.5 時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を薄層シ

リカゲルクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル 3：1）にて精製することにより、目的のチル 2-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチルチアゾール-2-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 0.15 g を得た。

融点：114-115℃

〔実施例 45〕

N-メチル 2-（2-（アザ（3-（2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸アミド（本発明化合物II-463）の合成

メチル 2-（2-（アザ（3-（2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸 1 g（2.35 mmol）をメタノール 40 ml に溶解し、次いで、40%メチルアミンメタノール溶液 1.83 g（23.5 mmol）を加え、室温にて 1 日間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム）にて精製することにより、目的の N-メチル 2-（2-（アザ（3-（2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）酢酸アミド 0.9 g を無色油状物として得た。

屈折率： n_{D20} 1.5632

〔実施例 46〕

N-メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）-6-メチルフェニル）酢酸アミド（本発明化合物No. IV-55）の合成

メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）-6-メチルフェニル）酢酸 0.5 g（1.18 mmol）をメタノール 5 ml に溶解し、次いで、40%メチルアミンメタノール溶液 10 g（0.13 mol）を加え、室温にて一週間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解した後、希塩酸および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウム

にて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的のN-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミドを無色結晶として得た。

融点: m.p. 152-154℃

〔実施例 47〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミド(本発明化合物II-568)の合成

N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸アミド 133mg (0.5mmol) を 1ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-エタノン 134mg (0.5mmol) を加え 50℃ にて 5 時間加熱攪拌した。反応混合物に水 5ml を加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=1:2)にて精製した後、ジエチルエーテルにて洗浄することにより、目的のN-メチル 2-(2-(アザ(3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミド 0.1g を無色結晶として得た。

融点: m.p. 175-177℃

〔実施例 48〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド(本発明化合物IV-65)の合成

N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸アミド 390mg (1.5mmol) を 5ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1

ーメチルピラゾールー3-イル)ー1-プロパノン430mg (1.5mmol)を加え50℃にて6時間加熱攪拌した。反応混合物に水15mlを加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のN-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド0.51gを無色結晶として得た。

融点: m.p.182-183℃

〔実施例49〕

メチル 2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)ーフェニル カーボネート (本発明化合物III-29) の合成

2-アミノフェノール1.25g (10mmol)をテトラヒドロフラン20mlに溶解し、これにメチルイソチオシアネート0.73g (10mmol)、トリエチルアミン1.02g (10mmol)および触媒量の4-(ジメチルアミノ)ーピリジンを加え、室温にて3日間攪拌した。テトラヒドロフランを留去し、水50mlを加え、濃塩酸にてpHを4に調製した後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコールにて洗浄することにより、1-(2-ヒドロキシーフェニル)ー3-メチルチオウレア1.25gを無色結晶として得た。

融点: 136℃< (分解)

引き続き得られた、1-(2-ヒドロキシーフェニル)ー3-メチルチオウレア1g (5.5mmol)を50mlのテトラヒドロフランおよび2mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これにフェナシルブロマイド1.1g (5.5mmol)を加えた。80℃にて5時間攪拌した後、溶媒を留去し、反応混合物に水50mlおよび1規定水酸化ナトリウム水溶液25mlを加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコ

ールにて洗浄することにより、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール 1.3 g を無色結晶として得た。

融点：151-153℃

引き続き得られた、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール 0.3 g をアセトニトリル 20 ml に溶解し、無水炭酸カリウムおよびクロロ蟻酸メチルエステルを加え室温にて、16時間攪拌した。反応混合物に水 300 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコールにて洗浄することにより、メチル 2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル カーボネート 0.2 g を無色結晶として得た。

融点：112-113℃

〔実施例 50〕

メチル (2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェノキシ)-酢酸 (本発明化合物 III-31) の合成

実施例 49 において得られた、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール 0.7 g をアセトニトリル 30 ml に溶解し、無水炭酸カリウムおよびプロモ酢酸メチルエステルを加え室温にて、16時間攪拌した。反応混合物に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル：n-ヘキサン=2：3) にて精製し、目的のメチル (2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェノキシ)-酢酸 0.1 g を無色結晶として得た。

融点：m.p. 119-121℃

〔実施例 51〕

(E)-メチル (3-メトキシ-2-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノキシ))-アクリル酸 (本発明化合物 III-32) の合成

55%水素化ナトリウム0.28g(6.42mmol)をヘキサンにて洗浄した後、N,N-ジメチルホルムアミドに懸濁させた。これに実施例50において得られた、メチル(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェノキシ)-酢酸1g(2.82mmol)および蟻酸メチル1.7g(28.3mmol)を加え、室温にて16時間攪拌した。反応混合物に無水炭酸カリウム6.24g(45.2mmol)次いでジメチル硫酸0.89g(7.06mmol)を加えさらに室温にて2時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1)にて精製することにより目的の(E)-メチル(3-メトキシ-2-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノキシ))-アクリル酸1gを無色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 3.34(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.60(m, 10H)

[実施例52]

(2-アゼパン-1-イルメチル-フェニル)-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-アミン(本発明化合物III-43)の合成

2-アミノベンジルアルコール12.3g(0.1mol)をテトラヒドロフラン100mlに溶解し、トリエチルアミン10.1g(0.1mol)およびメチルイソチオシアネート7.3g(0.1mol)を加え、室温にて16時間攪拌した。溶媒を留去し、得られた残渣をN,N-ジメチルホルムアミド100mlに溶解しフェナシルプロマイド19.9g(0.1mol)を加え室温にて16時間攪拌した。反応混合物にジエチルエーテル300mlを加え析出した結晶をろ取した。得られた結晶を水100mlに溶解し、2規定水酸化ナトリウム水溶液100mlを加え、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチル800mlに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、ろ過後減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェ

ニル) - メタノール 21.3 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2 - (3 - メチル - 4 - フェニル - 3 H - チアゾール - 2 - イリデンアミノ) - フェニル) - メタノール 2.96 g (10 mmol) を、塩化メチレン 100 ml に溶解し、5 から 10℃ にて、三臭化リン 2.71 g (10 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 16 時間攪拌した後、ジエチルエーテル 300 ml を加え析出した結晶をろ取することにより (2 - プロモメチル - フェニル) - (3 - メチル - 4 - フェニル - 3 H - チアゾール - 2 - イリデン) - アミン 5 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2 - プロモメチル - フェニル) - (3 - メチル - 4 - フェニル - 3 H - チアゾール - 2 - イリデン) - アミン 0.44 g (2 mmol) をヘキサメチレンイミン 200 mg (2 mmol)、N, N - ジメチルホルムアミド 5 ml および無水炭酸カリウム 276 mg (2 mmol) の混合物に加えた。室温にて 16 時間攪拌した後、水 20 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルおよびジエチルエーテルの混合液にて洗浄することにより、目的の (2 - アゼパン - 1 - イルメチル - フェニル) - (3 - メチル - 4 - フェニル - 3 H - チアゾール - 2 - イリデン) - アミン 0.19 g を無色結晶として得た。

融点：88-90℃

〔実施例 53〕

(3 - メチル - 4 - フェニル - 3 H - チアゾール - 2 - イリデン) - (2 - (5 - トリフルオロメチル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルメチル) - フェニル) - アミン (本発明化合物 III-44) の合成

実施例 1 により得られた、メチル 2 - (2 - (アザ (5 - メチル - 4 - フェニル - 2, 5 - チアゾリニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 2.03 g (6 mmol) を水 10 ml に懸濁し、これにヒドラジン 1 水和物 2.4 g (48 mmol) を加え加熱還流した。50 時間後、反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄すること

により、2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸ヒドラジド0.7gを無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)酢酸ヒドラジド0.8g(2.4mmol)を塩化メチレン10mlに溶解し、これに、トリフルオロ酢酸無水物504mg(2.4mmol)を加えた。室温に3時間攪拌し、減圧下溶媒を留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)にて精製し、得られた残渣をジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、N'-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)アセトトリフルオロアセトヒドラジド0.58gを無色結晶として得た。

引き続き得られた、N'-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)アセトトリフルオロアセトヒドラジド0.4g(0.84mmol)を1,2-ジクロロエタン10mlに溶解し、これに、オキシ塩化リン1.6mlを加え室温にて、2時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水20mlを加えた。2規定水酸化ナトリウム水溶液にてpH12に調製した後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製し、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的の、(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-(2-(5-トリフルオロメチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルメチル)-フェニル)-アミン0.19gを無色結晶として得た。

融点; 171-172℃

[実施例54]

(2-(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデンアミノ)-フェニル)-フェニル-メタノンO-メチル-オキシム(本発明化合物II-259)の合成

(2-アミノフェニル)-フェニル-メタノン10g(51mmol)、メ

トキシアミン塩酸塩 84 g (1.02 mol)、酢酸ナトリウム 83 g (1.02 mol)、水 20 ml およびエタノール 150 ml の混合物を還流下、5 日間攪拌した。不溶物をろ過し、ろ液を減圧下留去後、水 50 ml を加えた。析出した結晶をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、(2-アミノフェニル)-フェニル-メタノン O-メチル-オキシム 7 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた (2-アミノフェニル)-フェニル-メタノン O-メチル-オキシム 0.5 g (2.21 mmol) および参考例 22 により得られた (4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチル-アンモニウム 硫酸塩 0.816 g (2.21 mmol) を 1,2-ジクロロエタンに溶解し、これにトリエチルアミン 0.448 g (4.42 mmol) を加え、還流下、1 時間攪拌した。さらに、(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチル-アンモニウム 硫酸塩 0.5 g およびトリエチルアミン 0.5 g を加え、還流下、1 時間攪拌した。反応混合物に 3 規定塩酸を加えジエチルエーテルにて抽出した。有機層を 3 規定塩酸、次いで飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1:9) にて精製することにより、目的の (2-(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデンアミノ)-フェニル)-フェニル-メタノン O-メチル-オキシム 384 mg を淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm))

1.95(s, 3H), 3.95(s, 3H), 6.85-7.60(m, 12H)

〔実施例 55〕

2-メチル-5-メチルメルカプト-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン (本発明化合物 II-596) の合成

国際出願公開 WO 95/14009 号記載の方法を参考に、2-ニトロフェニ

ルイソシアネート 2 g (12.2 mmol) を 1, 2-ジクロロエタン 20 ml に溶解し、次いで 0℃ にて 5 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチルヒドラジン 0.67 g (14.6 mmol) を加えた。室温にて 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(2-ニトロフェニル)-3-メチル-セミカルバジド 2.59 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた 1-(2-ニトロフェニル)-3-メチル-セミカルバジド 0.76 g (3.62 mmol) をテトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、氷浴にて冷却した。次いでチオホスゲン 0.42 g (3.62 mmol) およびトリエチルアミン 0.73 g (7.24 mmol) を加え室温にて 16 時間攪拌した。不要物をろ別後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解し、これを水素化ナトリウム 0.43 g (10 mmol) の 10 ml テトラヒドロフラン懸濁液に滴下した。次いで、ヨウ化メチル 2.13 g (15 mmol) を加えた後、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合物に希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン:酢酸エチル=1:1) にて精製することにより、4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルメルカプト-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.58 g を黄色結晶として得た。

引き続き得られた 4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルメルカプト-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.3 g (1.13 mmol) を酢酸 10 mg および酢酸エチル 10 ml の混合溶媒に溶解し、これを 70℃ にて鉄粉 0.63 g (11.3 mmol)、酢酸 1 ml および酢酸エチル 2 ml の懸濁液に滴下した。70℃ にて 30 分攪拌後、室温まで冷却し、水 20 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 3-オキサチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩 0.77 g (2.1 mmol) および 1, 2-ジクロロエタン 10 ml を加

え、1時間加熱還流した。引き続き室温にて16時間攪拌した後さらに1.5時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）にて精製することにより、目的の2-メチル-5-メチルメルカプト-4-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン460mgを淡黄色油状物として得た。

〔実施例56〕

メチル 2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニルカルバミン酸（本発明化合物IV-83）の合成

2-（（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）-ニトロベンゼン1g（4.4mmol）、2-ブロモ-1-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-1-プロパノン1.26g（4.4mmol）およびN,N-ジメチルホルムアミド20mlの混合溶液を100℃にて8時間加熱攪拌した。反応混合物に水20mlを加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）にて精製することにより、2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）ニトロベンゼン1.5gを無色結晶として得た。

融点：77.5-78℃

引き続き得られた2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）ニトロベンゼン1.5g（3.91mmol）をメタノール35mlに溶解し、室温にて塩化第一銅1.2g（12mmol）および水素化ホウ素カリウム1.47g（27mmol）を加えた。室温にて1時間攪拌した後、さらに室温にて

塩化第一銅 1.2 g (12 mmol) および水素化ホウ素カリウム 1.47 g (27 mmol) を加えた。室温にて 1 時間攪拌した後、さらに塩化第一銅 1.2 g (12 mmol) および水素化ホウ素カリウム 1.47 g (27 mmol) を加えた。引き続き室温にて 1 時間攪拌した後、反応混合物をセライトろ過し、ろ液に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンを無色結晶(融点: 68-69℃)として得た。引き続き得られた 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンをジクロロメタン 20 ml に溶解し、次いでピリジン 0.2 g (2.5 mmol) およびクロロギ酸メチル 0.2 g (2.1 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて精製することにより、目的のメチル 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸 0.45 g を黄色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.40(s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.05(s, 3H), 6.92(s, 1H), 7.02(t, J=7.6Hz, 1H), 7.11(d, J=8.0Hz, 1H), 7.16(t, J=7.6Hz, 1H), 7.47(br, 1H), 8.18(d, J=7.2Hz, 1H)

[実施例 57]

メチル 2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸(本発明化合物 II-469)の合成

2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ-ニトロベンゼン 10 g (44.4 mmol) を 1,4-ジオキサン 80 ml に溶解し、これに 2-ブロモ-1-(4-メチルフェニル)-1-プロパノン 10.6 g (46.6 mmol) を加え、加熱還流下 2 日間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下溶媒を留去し、析出した結晶を水およびジイソプロピルエーテルにて洗浄

する事により、2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ニトロベンゼン12gを無色結晶として得た。

引き続き得られた2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ニトロベンゼン5g(15.3mmol)をメタノール120mlに溶解し、室温にて塩化第一銅22.8g(230mmol)および水素化ホウ素カリウム29g(537mmol)を5回に分けて少量ずつ加えた。反応混合物をセライトおよびシリカゲルにてろ過し、ろ液に水および飽和アンモニア水を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ついでシリカゲルろ過した後、減圧下溶媒を留去することにより2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンを得た。

引き続き得られた2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリン0.2g(0.68mmol)をジクロロメタン3mlに溶解し、次いでピリジン64mg(0.81mmol)およびクロロギ酸メチル70mg(0.74mmol)を加え、室温にて30分間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1規定塩酸および食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン:クロロホルム=1:9)にて精製することにより、目的のメチル2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸0.15gを無色結晶として得た。

融点: 104-106℃

〔実施例58〕

メチル (メトキシメチル(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル))カルバミン酸(本発明化合物IV-89)の合成

メチル (メトキシメチル(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル))カルバミン酸294mg(0.99mmol)、2-ブromo

－1－（5－トリフルオロメチル－1－メチルピラゾール－3－イル）－1－ブ
 ロパノン282mg（0.99mmol）およびN，N－ジメチルホルムアミド
 3mlの混合溶液を50℃にて3時間加熱攪拌した。反応混合物を室温まで冷却
 した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフ
 ィー（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：2）にて精製することにより、目的のメ
 チル（メトキシメチル（2－（アザ（3－（5－トリフルオロメチル－1－メ
 チルピラゾール－3－イル）－4－メチル－2，5－オキサチオレニリデン）メ
 チル）フェニル））カルバミン酸0.3gを無色結晶として得た。

融点：100－103℃

〔実施例59〕

メチル（2－（アザ（3－（5－トリフルオロメチル－1－メチルピラゾー
 ル－3－イル）－4－メチル－2，5－オキサチオレニリデン）メチル）－6－
 メチルフェニル）カルバミン酸（本発明化合物IV-93）の合成

メチル（メトキシメチル（2－（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）ア
 ミノ）－6－メチルフェニル）カルバミン酸0.5g（1.6mmol）、2
 －ブロモ－1－（5－トリフルオロメチル－1－メチルピラゾール－3－イル）
 －1－ブプロパノン458mg（1.6mmol）およびN，N－ジメチルホルム
 アミド2mlの混合溶液を50℃にて2時間加熱攪拌した。反応混合物を室温ま
 で冷却した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマト
 グラフイー（n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：2）にて精製することにより、メ
 チル（メトキシメチル（2－（アザ（3－（5－トリフルオロメチル－1－メ
 チルピラゾール－3－イル）－4－メチル－2，5－オキサチオレニリデン）メ
 チル）－6－メチルフェニル）カルバミン酸0.595gを無色結晶として得
 た。引き続き得られた、メチル（メトキシメチル（2－（アザ（3－（5－ト
 リフルオロメチル－1－メチルピラゾール－3－イル）－4－メチル－2，5－
 オキサチオレニリデン）メチル）－6－メチルフェニル）カルバミン酸0.5
 95g（1.27mmol）をジクロロメタン4mlに溶解し、氷浴にて冷却し
 た後、三臭化ホウ素0.18ml（1.9mmol）を加え、室温にて16時間
 攪拌した。さらに、三臭化ホウ素0.2ml（2.1mmol）を加え、室温に

て3時間攪拌した後、ジクロロメタン4mlを加え、氷浴にて冷却した。トリエチルアミン3g(30mmol)を加えた後、反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=3：2)にて精製することにより、2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルアニリン0.17gを得た。引き続き得られた、2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルアニリン0.17g(0.46mmol)をジクロロメタン3mlに溶解し、次いでピリジン44mg(0.55mmol)およびクロロギ酸メチル48mg(0.5mmol)を加え、室温にて30分間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1規定塩酸および食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、目的のメチル 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)カルバミン酸0.17gを無色結晶として得た。
融点：55-58℃

[実施例60]

(E)-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-3-メトキシ-2-プロペン酸(本発明化合物IV-91)の合成

2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)ヨードベンゼン1.5g(3.2mmol)、テトラキストリフェニルホスフィン0.2g(0.1mmol)およびテトラヒドロフランの混合溶液に、テトラヘドロン(Tetrahedron)第54巻、7595頁(1998年)記載の方法により得られた、0.79M (Z)-2-メトキシ-1-(メトキシカルボニル)エテニ

ルジnkヨージド TMEDA錯体 15 ml を加え 60℃にて 2 時間攪拌した後、引き続き室温にて 16 時間攪拌した。さらに、60℃にて 5 時間攪拌した後、反応混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）にて精製することにより得られた結晶を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的の（E）-メチル 2-（2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）-3-メトキシ-2-プロペン酸 0.6 g を無色結晶として得た。

融点：140-142℃

〔実施例 61〕

2-メチル-5-メチルスルホニル-4-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）-2, 4-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン（本発明化合物 II-600）の合成

実施例 55 にて得られた 4-（2-ニトロフェニル）-2-メチル-5-メチルメルカプト-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 1 g（3.76 mmol）を、酢酸 20 ml に溶解し、ついで 35% 過酸化水素水溶液 5 ml を加え 80℃にて、2 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-（2-ニトロフェニル）-2-メチル-5-メチルスルホニル-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.96 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた 4-（2-ニトロフェニル）-2-メチル-5-メチルスルホニル-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.3 g（1 mmol）を酢酸 10 ml および酢酸エチル 10 ml の混合溶媒に溶解したも

のを、70℃にて、鉄粉0.56g(10mmol)、酢酸1mlおよび酢酸エチル2mlの懸濁液に滴下した。滴下終了後、反応混合物を室温まで冷却し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン0.15gを無色結晶として得た。引き続き得られた、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン0.15g(0.56mmol)をジクロロエタンに溶解し、これに参考例24にて得られた(4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩0.42g(1.1mmol)を加え、3時間加熱還流した。引き続き反応混合物を室温にて終夜攪拌した後、さらに3時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3~3:2)にて精製することにより、目的の2-メチル-5-メチルスルホニル-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン0.17gを淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 2.28(s, 3H), 3.20(s, 3H), 3.60(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)

〔実施例62〕

2-メチル-5-メトキシ-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン(本発明化合物II-601)の合成

ナトリウムメトキシドの23%メタノール溶液3.69g(0.9mmol)および1,2-ジメトキシエタンの混合溶液に、実施例61にて得られた、4-

(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.5 g (1.68 mmol) を加え、2 時間加熱還流した後、引き続き室温にて終夜攪拌した。さらに、6.5 時間加熱還流した後、ナトリウムメトキシドの 23% メタノール溶液 1 ml を加え、0.5 時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却し、水および希塩酸を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=2：1～4：1）にて精製することにより、4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.19 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた 4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.19 g (0.76 mmol) を酢酸 5 ml および酢酸エチル 5 ml の混合溶媒に溶解したものを、70℃にて、鉄粉 0.42 g (7.6 mmol)、酢酸 1 ml および酢酸エチル 2 ml の懸濁液に滴下した。滴下終了後、反応混合物を室温まで冷却し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.08 g を無色結晶として得た。引き続き得られた、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.08 g (0.36 mmol) をジクロロエタン 5 ml に溶解し、これに参考例 24 にて得られた (4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1, 3] オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩 0.27 g (0.72 mmol) を加え、3 時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1）にて精製すること

により、目的の 2-メチル-5-メトキシ-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン 0.18 g を淡黄色油状物として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 2.28(s, 3H), 3.40(s, 3H), 3.90(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)

〔参考例 1〕

メチル 2-(2-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸の合成

2-(2-ニトロフェニル)酢酸 18 g (0.1 mol) をメタノール 400 ml に溶解し、これに濃硫酸 5 ml を加えた後、3 時間加熱還流した。メタノールを留去した後、氷水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、メチル 2-(2-ニトロフェニル)酢酸を無色油状物として 20 g 得た。

続いて、得られたメチル 2-(2-ニトロフェニル)酢酸 15 g (75 mmol) をメタノールに溶解し、これに 5% パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた後、水素雰囲気下室温にて 3 時間攪拌した。パラジウム-活性炭をろ別後、減圧下メタノールを留去することによりメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 12.3 g を淡黄色油状物として得た。

続いて、得られたメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 7 g (42.4 mmol) を無水テトラヒドロフラン 40 ml に溶解し、これにイソチオシアン酸メチル 3.1 g (42.4 mmol)、トリエチルアミン 4.3 g (42.4 mmol) および 4-ジメチルアミノピリジン 0.5 g を加え、室温にて攪拌した。96 時間後、減圧下溶媒を留去し、得られた反応混合物に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルの混合溶媒にて洗浄することによりメチル 2-(2-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 6.5

g を無色結晶として得た。

融点；99－100℃

〔参考例2〕

トリエチルアンモニウム 2－（2－メトキシ－2－オキソエチル）フェニル
カルバモジチオエートの合成

メチル 2－（2－アミノフェニル）酢酸60.4g（0.37mol）のベンゼン（120ml）溶液を氷冷し、二硫化炭素27.9g（0.37mol）およびトリエチルアミン37.1g（0.37mol）を加え、冷蔵庫で1週間静置した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテル200mlを加え、30分間攪拌した。析出した結晶を沈殿させ、上澄み液を除去し、再びジエチルエーテル200mlを加えて30分間攪拌した。結晶を減圧下でろ過し、減圧乾燥することにより目的のトリエチルアンモニウム 2－（2－メトキシ－2－オキソエチル）フェニルカルバモジチオエート117gを淡黄色結晶として得た。

〔参考例3〕

メチル 2－（2－イソチオシアネートフェニル）酢酸の合成

トリエチルアンモニウム 2－（2－メトキシ－2－オキソエチル）フェニルカルバモジチオエート90g（0.26mol）、トリエチルアミン26.6g（0.26mol）およびクロロホルム200mlの混合液を氷冷し、クロロギ酸エチル28.6g（0.26mol）を加えた。反応液を室温に戻し、さらに1、5時間攪拌した。反応液に1規定水酸化ナトリウム水溶液300mlを加え、有機層と水層を分離し、水層をクロロホルムにて抽出し、先の有機層に加えた。この有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下で溶媒を留去することにより目的のメチル（2－イソチオシアネートフェニル）酢酸55.8gを淡黄色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21} 1.5032$

〔参考例4〕

メチル 2－（2－（（メチルイミノ）メチレン）アミノ）フェニル）酢酸
の合成

メチル 2－（2－（（メチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）フェニル

酢酸 2.38 g (10 mmol)、トリエチルアミン 3.03 g (30 mmol) および 4-(ジメチルアミノ)ピリジン 50 mg (0.4 mmol) をクロロホルム 100 ml に溶解し、そこに 25℃以下でメタンスルホンクロライド 2.29 g (20 mmol) を滴下した。室温で 1 時間攪拌した後、反応液を水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-((メチルイミノ)メチレン)アミノ)フェニル)酢酸 1.5 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率; n_D^{25} : 1.5032

〔参考例 5〕

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸の合成

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 5 g (24.2 mmol) のテトラヒドロフラン 50 ml 溶液を氷冷し、ジメチルアミン(40%水溶液) 2.8 g (24.8 mmol) を加えた。反応液を室温に戻し、さらに 30 分間攪拌した後、溶媒を減圧留去し、析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄し、減圧乾燥することにより目的のメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 4.9 g を無色結晶として得た。

融点; 110-113℃

〔参考例 6〕

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2,2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2-メチルチオビニル)フェニル)酢酸(化合物VII-30)の合成

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 2.9 g (14 mmol) およびトリメチルシリルメタンチオール 1.68 g (14 mmol) をエタノール 20 ml に溶解した後、触媒量の 1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデク-7-エンを加え、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去し、水を加えた。クロロホルムにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去することにより目的とするメチル 2-(2-((2,2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2

ーメチルチオビニル) フェニル) 酢酸 4. 75 g を粗精製物として得た。

得られた粗精製物をアセトン 20 ml に溶解し、氷冷下で炭酸カリウム 2. 32 g (16. 8 mmol) およびメチル トリフルオロメタンスルホン酸 4. 60 g (28 mmol) を加え、氷冷下で 2 時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル=5: 1) にて精製することにより目的のメチル 2- (2- (1-アザ-2- (2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ) -2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 4. 5 g を無色油状物として得た。

屈折率; n_D^{21} : 1. 5676

〔参考例 7〕

メチル 2- (2- (1-アザ-2- (2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ) -2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 (化合物 VII-31) の合成

メチル 2- (2- (1-アザ-2- (2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ) -2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 1. 03 g (3 mmol)、ベンズアルデヒド 3. 18 g (30 mmol) およびフッ化セシウム 0. 92 g (6. 1 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (6 ml) に溶解し、窒素雰囲気下、室温で 3 日間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル=2: 1) にて精製することによりメチル 2- (2- (1-アザ-2- (2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ) -2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 0. 3 g を得た。

〔参考例 8〕

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-エチルフェニル) 酢酸の合成

水 150 ml および濃塩酸 100 ml の混合液に、硝酸ナトリウム 15 g (176 mmol) を加え、次いで市販の 4-エチルフェノール 20 g (164 mmol)

o 1) をジクロロメタン 150 ml およびジエチルエーテル 300 ml の混合溶媒に溶解したものをゆっくりと加えた。さらに反応混合物に無水酢酸 1.5 ml を加え、室温にて、5 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 9 : 1) にて精製することにより、4-エチル-2-ニトロフェノール 20.7 g を得た。

引き続き、得られた 4-エチル-2-ニトロフェノール 16.8 g (0.1 mol) およびピリジン 9.54 g (0.12 mol) をジクロロメタン 200 ml に溶解し、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 31 g (0.11 mol) をゆっくりと加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 2 時間攪拌した後、水および飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去することにより、トリフルオロメタンスルホン酸 (4-エチル-2-ニトロフェニル) エステル 29 g を得た。

55% 水素化ナトリウム 9.7 g (0.22 mol) をヘキサンにて洗浄後、N, N-ジメチルホルムアミド 220 ml に懸濁し、氷冷下、マロン酸ジメチル 32 g (0.24 mol) を加えた。反応混合物を 45℃ まで昇温し、1 時間攪拌した。次いで、トリフルオロメタンスルホン酸 (4-エチル-2-ニトロフェニル) エステル 29 g (97 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 30 ml に溶解したものを滴下し、さらに 45~50℃ にて 3 時間加熱攪拌した。次いで、反応混合物を室温まで冷却した後、さらに 12 時間攪拌した。反応混合物を水 250 ml に注ぎ、濃塩酸を加え溶液を酸性に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-(4-エチル-2-ニトロフェニル) マロン酸ジメチル 42.5 g を得た。

引き続き、得られた 2-(4-エチル-2-ニトロフェニル) マロン酸ジメチル 42.5 g を酢酸 150 ml および濃塩酸 150 ml の混合溶媒に溶解し、還流下 3 時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減

圧下溶媒を留去した。得られた残渣をメタノール 200 ml に溶解し、濃硫酸 2 ml を加えた後、還流下 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去することによりメチル 2- (4-エチル-2-ニトロフェニル) 酢酸 17.6 g を得た。

引き続き得られた 2- (4-エチル-2-ニトロフェニル) 酢酸メチル 16 g (71.7 mmol) を酢酸エチルに溶解し、これに 5% パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を氷冷し、チオホスゲン 5.6 ml (73 mmol) を加えた後、70~80℃にて 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50% ジメチルアミン水溶液 20 g (222 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 3 時間攪拌した後、水および濃塩酸を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄する事により、メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-エチルフェニル) 酢酸 11.5 g を得た。

融点: 109-111℃

また、原料として、4-エチルフェノールの代わりに、相当するフェノールを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-
t-ブチルフェニル) 酢酸

融点: 125-127℃

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-
プロピルフェニル) 酢酸

融点: 73-75℃

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-
i-プロピルフェニル) 酢酸

融点: 112-115℃

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -4-

6-ジメチルフェニル) 酢酸

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 2.29(s, 3H), 2.33(s, 3H), 3.39(s, 6H), 3.63(s, 2H), 3.70(s, 3H), 6.88(s, 1H), 7.21(s, 1H), 8.21(s, 1H)

〔参考例9〕

メチル 2-(2-(4-(ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メチルフェニル) 酢酸の合成

2-クロロ-5-メチルニトロベンゼン 25.73 g (0.15 mol)、マロン酸ジメチル 43.56 g (0.33 mol)、炭酸カリウム 68.31 g (0.495 mol) および N,N-ジメチルホルムアミド 330 ml の混合物を 100℃ にて 12 時間加熱撹拌した。反応混合物を水 330 ml に注ぎ、濃塩酸 75 ml を加え pH 2 に調整した。析出した結晶をろ取り、得られた結晶を酢酸エチルに溶解した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) マロン酸ジメチル 34.9 g を得た。

引き続き得られた、2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) マロン酸ジメチル 34.9 g をエタノール 165 ml に溶解し、次いで 4 規定水酸化ナトリウム水溶液を加え 60℃ にて 90 分間撹拌した。減圧下エタノールを留去し、次いで水 100 ml および濃塩酸 65 ml を加え pH 2 に調整した後、さらに還流下 1 時間撹拌した。反応混合物を室温まで冷却し、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) 酢酸 18.2 g を得た。

2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) 酢酸 36.8 g (189 mmol) をメタノール 500 ml に溶解し、濃硫酸 6.5 ml を加えた後、還流下 1 時間撹拌した。メタノールを留去した後、氷水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 38.2 g を得た。

引き続き得られた 2-(2-ニトロ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 38.

2 g (18.3 mmol) をメタノール 300 ml に溶解し、これに 5 % パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2-(2-アミノ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 32.5 g を得た。

2-(2-アミノ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 0.76 g (4.25 mmol) を N,N-ジメチルホルムアミド 12.5 ml に溶解し、これに 1,1-チオカルボニルジイミダゾール 0.81 g (4.54 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。次いで、40 % ジメチルアミン水溶液 0.5 g (4.44 mmol) を加えさらに室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1 N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去することによりメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メチルフェニル) 酢酸 1.1 g を無色結晶として得た。

融点：97-98℃

また、原料として、2-クロロ-5-メチルニトロベンゼンの代わりに、相当する 2-ハロゲンニトロベンゼンを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-3-フルオロフェニル) 酢酸

融点：145-148℃

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-フルオロフェニル) 酢酸

融点：93-94℃

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-トリフルオロフェニル) 酢酸

融点：87-90℃

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メトキシフェニル) 酢酸

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 2.29(s, 3H), 2.33(s, 3H), 3.39(s, 6H), 3.63(s, 2H), 3.70(s, 3H), 6.88(s, 1H), 7.21(s, 1H), 8.21(s, 1H)

〔参考例 10〕

メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -6-メチルフェニル) 酢酸の合成

パラホルムアルデヒド 9.9 g (0.33 mmol) および 85% 水酸化カリウム 1.44 g をジメチルスルホキシド 50 ml に溶解し、ついで、2,3-ジメチルニトロベンゼン 16.5 g (0.11 mmol) をジメチルスルホキシド 50 ml に溶解したものを加えた。さらに 15 分おきに 85% 水酸化カリウム 1.44 g を 4 回に分けて加えた後、水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2- (2-ニトロ-6-メチルフェニル) エチルアルコール 19.4 g を得た。

引き続き得られた 2- (2-ニトロ-6-メチルフェニル) エチルアルコール 19.4 g (107 mmol) をアセトン 350 ml に溶解し、氷冷下 2.5 規定のジョーンズ試薬 (John's Reagent) 94.5 ml (236 mmol) を加え、室温にて 5 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて抽出した。水層を酢酸エチルにて洗浄し、濃塩酸にて酸性とした後、再び、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2- (2-ニトロ-6-メチルフェニル) 酢酸 14.9 g を得た。

引き続き、2- (2-ニトロ-6-メチルフェニル) 酢酸 10 g (51.3 mmol) をメタノール 100 ml に溶解し、濃硫酸 2 ml を加えた後、還流下 1.5 時間攪拌した。メタノールを留去した後、氷水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、2- (2-ニトロ-6-メチルフェニル) 酢酸メチル 10.8 g を得た。

引き続き得られた 2- (2-ニトロ-6-メトキシフェニル) 酢酸メチル 10

． 8 g (52 mmol) をメタノール 50 ml に溶解し、これに 5 % パラジウム－活性炭 0.2 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム－活性炭をろ別した。得られたろ液を減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2－(2－アミノ－6－メチルフェニル) 酢酸メチル 9.2 g を得た。

2－(2－アミノ－6－メチルフェニル) 酢酸メチル 9.2 g (51 mmol) を酢酸エチル 100 ml に溶解し、氷冷下、チオホスゲン 4.34 ml (57 mmol) を加えた後、70～80℃にて 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50 % ジメチルアミン水溶液 23 g (256 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 3 時間攪拌した後、水および濃塩酸を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をろ別し、ろ液を濃縮後得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n－ヘキサン：酢酸エチル＝3：2) にて精製することにより、メチル 2－(2－((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ)－6－メチルフェニル) 酢酸 4.8 g を無色結晶として得た。

融点：121-123℃

また、原料として、3, 4－ジメチルニトロベンゼンの代わりに、相当する 2－メチルニトロベンゼンを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2－(2－((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ)－6－メトキシフェニル) 酢酸

融点：119-120℃

〔参考例 11〕

2－ブロモ－1－(2－フルオロ－4－トリフルオロメチルフェニル)－1－プロパノンの合成

市販の 1－(2－フルオロ－4－トリフルオロメチルフェニル)－1－プロパノン 11.05 g (50.2 mmol) をクロロホルム 110 ml に溶解し、次いで、臭素 8.03 g (50.2 mmol) を加え室温にて、1 時間攪拌した。反応混合物を氷水および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の混合物に注ぎ、クロロ

ホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-プロモ-1-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパノン14.89gを得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , δ (ppm)) : 1.91(d, $J=5.5\text{Hz}$, 3H), 5.26(q, $J=5.5\text{Hz}$, 1H), 7.3-7.95(m, 3H)

[参考例12]

2-プロモ-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノンの合成

市販の3, 4, 5-トリフルオロベンゾイルクロリド5.34g (27.45 mmol) をジクロロメタン20mlに溶解し氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩3.21g (32.94 mmol) およびトリエチルアミン6.67g (65.88 mmol) を加え室温にて、18時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を1規定塩酸および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより3, 4, 5-トリフルオロベンゾイル-N-メトキシ-N-メチルアミド5.74gを得た。引き続き得られた、3, 4, 5-トリフルオロベンゾイル-N-メトキシ-N-メチルアミド2.5g (11.41 mmol) をテトラヒドロフラン40mlに溶解し、 -78°C にて、0.89Mエチルマグネシウムブロミド15.4ml (13.69 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、22時間攪拌した後、1N塩酸水溶液50mlに注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することにより、1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.25gを得た。

続いて得られた1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.25g (6.64 mmol) を1, 2-ジクロロエタン30mlに溶解し、次いで、臭素1.06g (13.29 mmol) を加え室温にて3時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、1, 2-ジクロロエタン

層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.72 gを得た。

〔参考例13〕

2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノンの合成

市販の2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-1-エタノン1 g (4.28 mmol) をN, N-ジメチルホルムアミド10 mlに溶解し、次いで、メチルメルカプタンナトリウム0.33 g (4.71 mmol) を加え室温にて、6時間攪拌した。反応混合物に水50 mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をクロロホルム15 mlに溶解し、次いで、臭素0.64 g (7.97 mmol) を加え室温にて4.5時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノン1.1 gを得た。

〔参考例14〕

2-ブロモ-1-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-プロパン-1-オンの合成

1, 1, 1-トリフルオロ-2, 4-ペンタノン50.7 g (0.33 mol) をエタノール300 mlに溶解し、-30℃に冷却した。次いで、ヒドラジン1水和物16.5 g (0.33 mol) をエタノール50 mlに溶解したものをゆっくりと加えた後、還流下2時間攪拌した。次いで、減圧下溶媒を留去し、トルエン300 mlを加えた。さらに、還流下5時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去することにより、5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール49 gを得た。次いで、得られた5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール49 g (0.33 mol) に水600 mlおよび過マンガン酸カリウム56.7 g (0.33 mol) を加え、80℃にて1時間攪拌した。さらに水1

00 ml および過マンガン酸カリウム 56.7 g (0.33 mol) を加え、90℃にて3時間攪拌した後、エタノール 10 ml を加えさらに5分間攪拌した。反応混合物を熱時ろ過により、不溶物をろ別し、減圧下溶媒を約3分の1になるまで留去した。得られた残渣に濃塩酸を加え酸性にした後、酢酸エチルにて抽出後、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 40 g を得た。得られた5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 20 g (0.11 mol) をエタノール 250 ml に溶解し、次いで、濃硫酸 25 ml を加えた後、還流下4時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解した後、水および飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル 23.7 g を得た。

引き続き、水素化ナトリウム 0.595 g (13.6 mmol) をテトラヒドロフラン 25 ml に懸濁し、氷冷下、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル 2.58 g (12.4 mmol) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応混合物にヨウ化メチル 1.94 g (13.6 mmol) を加え、室温にて12時間攪拌後、水素化ナトリウム 0.3 g およびヨウ化メチル 2 g を加え、さらに2時間攪拌した。さらに、還流下2時間攪拌し、氷水に注いだ後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をメタノール 10 ml に溶解し、水および水酸化ナトリウム 0.744 g (18.6 mmol) を加え室温にて12時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。水および濃塩酸を加え酸性とした後、析出した結晶をろ取することにより、5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸 2 g を得た。引き続き得られた5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸 2 g (10.3 mmol) をベンゼン 10 ml に溶解し、次いで、塩化チオニル 2.45 g (20.6 mmol) およびN,N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加え、還流下2.5時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン 20 ml を

加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 1.51 g (15.5 mmol) およびトリエチルアミン 4.17 g (40.3 mmol) を加え室温にて、12 時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 2.4 g を得た。引き続き得られた、5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 2.37 g (10 mmol) をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解し、-78℃にて、0.89 M エチルマグネシウムブロミド 13.5 ml (12 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3 時間攪拌した後、さらに 0.89 M エチルマグネシウムブロミド 13.5 ml (12 mmol) を加えた。引き続き室温にて 12 時間攪拌し、1.5 N 塩酸水溶液 120 ml に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 2 g を得た。

続いて得られた 1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 1 g (4.9 mmol) をクロロホルム 5 ml に溶解し、次いで、臭素 0.543 g (3.4 mmol) および 48% 臭化水素酸水溶液 1 滴を加え室温にて 12 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 1.16 g を得た。

[参考例 15]

2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパン-1-オンの合成

参考例 14 で得られた 5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 10 g (0.556 mol) をベンゼン 80 ml に溶解し、次いで、塩化

チオニル 10 g (85 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加え、還流下 4 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタンを加え氷冷した。次いで、N-メチル-*O*-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 5.5 g (56.4 mmol) およびトリエチルアミン 15 g を加え室温にて、2 時間攪拌した。反応混合物に、水および濃塩酸を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 5-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 11 g を得た。引き続き得られた、5-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 11 g をテトラヒドロフラン 200 ml に溶解し、-70℃にて、0.89 M エチルマグネシウムブロミド 116.3 ml (148 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3 時間攪拌した後、希塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(5-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 11 g を得た。

続いて得られた 1-(5-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 6.71 g (34.95 mmol) をクロロホルム 70 ml に溶解し、次いで、臭素 6.2 g (38.75 mmol) および 48% 臭化水素酸水溶液 5 滴を加え 35℃にて 2 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1*H*-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 10 g を得た。

[参考例 16]

2-ブロモ-1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパン-1-オンの合成

1, 1, 1-トリフルオロ-2, 4-ペンタノン 10 g (64.9 mmol) をエタノール 40 ml に溶解し、-30℃に冷却した。次いで、メチルヒドラジン 2.99 g (64.9 mmol) を水 5.5 ml に溶解したものをゆっくりと

加えた後、還流下4時間攪拌した。次いで、減圧下溶媒を留去し、水を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、1, 5-ジメチル-3-トリフルオロメチルピラゾール7 gを得た。次いで、得られた1, 5-ジメチル-3-トリフルオロメチルピラゾール7 g (42.7 mmol) に水200 ml および過マンガン酸カリウム7.08 g (44.8 mmol) を加え、100℃にて1.5時間攪拌した。さらに水50 ml および過マンガン酸カリウム7.08 g (44.8 mmol) を加え、100℃にて2時間攪拌した後、エタノール5 ml を加えさらに10分間攪拌した。反応混合物を熱時ろ過により、不溶物をろ別し、得られたろ液に濃塩酸を加え酸性にした後、析出した結晶をろ取することにより、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸3.39 gを得た。得られた1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸3.39 g (17.5 mmol) をベンゼン10 ml に溶解し、次いで、塩化チオニル4.16 g (35 mmol) およびN, N-ジメチルホルムアミド1滴を加え、還流下3時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン50 ml を加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩2.57 g (26.3 mmol) およびトリエチルアミン7.07 g (70 mmol) を加え室温にて、2時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド3.96 gを得た。引き続き得られた、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド3.96 g (16.7 mmol) をテトラヒドロフラン40 ml に溶解し、-78℃にて、0.89 Mエチルマグネシウムブロミド22.5 ml (20 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、24時間攪拌した後、1.5 N塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパノン3.9 gを得た。

続いて得られた1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパノン0.8g(3.88mmol)をクロロホルム6mlに溶解し、次いで、臭素0.621g(3.88mmol)および48%臭化水素酸水溶液1滴を加え室温にて12時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパノン0.84gを得た。

〔参考例17〕

2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパノンの合成

窒素雰囲気下、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン7.86g(43.3mmol)、青酸亜鉛10.16g(86.5mmol)およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)5g(4.33mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド80mlに懸濁し、90℃にて3時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、アンモニア水および氷水の混合物に注いだ後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-シアノ-5-トリフルオロメチルピリジン11g(純度約60%)を得た。得られた2-シアノ-5-トリフルオロメチルピリジン6g(23.6mmol)をテトラヒドロフラン30mlに溶解し、-78℃にて0.89Mエチルマグネシウムブロミド53ml(47.2mmol)を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、2時間攪拌した後、2N塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=20:1)にて精製することにより、することにより、1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパノン2.7gを得た。引き続き得られた1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパノン2.6g(12.9mmol)をクロロホルムに溶解し、臭素2.06g(12

． 9 mmol) を加え室温にて16時間攪拌した。次いで、還流下1時間攪拌し、室温まで冷却後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパノン 3.5 g を得た。

〔参考例18〕

2-ブロモ-1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノンの合成

エチルビニルエーテル 10 g (139 mmol)、ジクロロメタン 100 ml およびピリジン 13.2 g (167 mmol) の混合物を氷冷し、次いで、トリフルオロ酢酸無水物 32 g (153 mmol) を加え、室温にて、4時間攪拌した。反応混合物を水 100 ml にて洗浄し、1規定塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-エトキシ-1, 1, 1-トリフルオロ-3-ブテン-2-オン 23.5 g を得た。

続いて得られた、4-エトキシ-1, 1, 1-トリフルオロ-3-ブテン-2-オン 10 g (59.5 mmol)、3-ジメチルアミノアクリロニトリル 5.72 g (59.5 mmol) およびトルエン 10 ml の混合物を 100℃にて4時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、n-ヘキサン 30 ml を加えた。析出した結晶をろ取した。得られた結晶をN,N-ジメチルホルムアミド 30 ml に溶解し、酢酸アンモニウム 3.4 g (89.3 mmol) を加え、室温にて16時間攪拌した。反応混合物に水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および法食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-トリフルオロメチル-5-シアノピリジン 4.1 g を得た。

2-トリフルオロメチル-5-シアノピリジン 8.36 g (48.6 mmol) をエタノール 50 ml に溶解し、水 5 ml および水酸化ナトリウム 2.33 g (58.3 mmol) を加え還流下5時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。水および濃塩酸を加え酸性とした後、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を

ベンゼン100mlに溶解し、次いで、塩化チオニル10.42g(87.6mmol)およびN,N-ジメチルホルムアミド2滴を加え、還流下2時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン120mlを加え氷冷した。次いで、N-メチル-N-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩6.4g(65.7mmol)およびトリエチルアミン13.3g(131.4mmol)を加え室温にて、16時間攪拌した。反応混合物に水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン25mlに溶解し、-78℃にて、0.89Mエチルマグネシウムブロミド17.3ml(15.4mmol)を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3時間攪拌した後、1.5N塩酸水溶液120mlに注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(2-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン2gを得た。

続いて得られた1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン1g(4.9mmol)をクロロホルム5mlに溶解し、次いで、臭素0.543g(3.4mmol)および48%臭化水素酸水溶液1滴を加え室温にて12時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン2gを得た。得られた1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン1g(4.93mmol)をクロロホルム10mlに溶解し、臭素0.787g(4.93mmol)および、48%臭化水素酸3滴を加え還流か30分間攪拌した。室温まで冷却後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-プロモ-1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン1.39gを得た。

[参考例19]

2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノールの合成

窒素雰囲気下、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン15g(82.6mmol)、青酸亜鉛19.4g(165.2mmol)およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)9.55g(8.26mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド150mlに懸濁し、80℃にて4.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、アンモニア水50mlおよび氷水250mlの混合物に注いだ後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をエタノール80mlに溶解し、水酸化ナトリウム3.97g(99.1mmol)を水8mlに溶解した溶液を加えた。還流下2.5時間攪拌し、さらに水酸化ナトリウム1g、エタノール30mlおよび水3mlを加え2.5時間攪拌した。反応混合物から減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水50mlを加えた後、ジエチルエーテルにて洗浄後、濃塩酸を加え、pH2に調整した。析出した結晶をろ取することにより、5-トリフルオロメチルピコリン酸9.1gを得た。引き続き得られた5-トリフルオロメチルピコリン酸8.63g(45.2mmol)をベンゼン50mlに溶解し、次いで、塩化チオニル8.06g(67.8mmol)を加え、還流下2時間攪拌した。反応混合物から、減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチルピコリン酸クロライド8.62gを得た。

引き続き、氷冷下、塩化マグネシウム0.74g(7.73mmol)、マロン酸ジメチル1.02g(7.73mmol)、トリエチルアミン1.56g(15.47mmol)およびアセトニトリル10mlの混合物に5-トリフルオロメチルピコリン酸クロライド1.5g(7.16mmol)を加え、室温にて、1時間攪拌後、水100mlに注いだ。濃塩酸を加え、pH3に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジメチルスルホキシド10mlに溶解し、水0.28gを加え、140℃にて1時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、水100mlに注ぎ、酢酸エチルにて抽

出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。引き続き得られた残渣をクロロホルム 10 ml に溶解し、臭素 1.02 g (6.35 mmol) を加え、還流下 2 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および氷水の混合液に注ぎ、クロロホルムにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノン 1.7 g を得た。

〔参考例 20〕

2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 2 g (7.94 mmol) を 1,4-ジオキサン 100 ml に溶解し、これに 2-オキソ-3-プロモブタン酸 1.58 g (8.73 mmol) を加えた後、0.5 時間加熱還流した。減圧下 1,4-ジオキサンを留去した後、反応混合物に水を加え酢酸エチルにて抽出した。続いて有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて抽出した。得られた水層に 1 N 塩酸を加えて酸性にした後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄することにより目的の 2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸 1.8 g を茶褐色油状物として得た。

〔参考例 21〕

N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -6-メチルフェニル) 酢酸アミドの合成

参考例 10 にて得られたメチル 2-(2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -6-メチルフェニル) 酢酸 1.33 g (5 mmol) をメタノール 10 ml に溶解し、次いでメチルアミンの 40% メタノール溶液 3.9 g (50 mmol) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。減圧下反応溶液を留去し、析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄する事により、目的の N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) -6-メチルフェ

ニル) 酢酸アミド 1.25 g を無色結晶として得た。

融点: °C

同様に、参考例 5 にて得られたメチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸を原料として用いて、N-メチル 2- (2- ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸アミドを得た。

融点: 149-151 °C

〔参考例 22〕

(4- (2, 6-ジフルオロフェニル) -5-メチル- [1, 3] ジチオール-2-イリデン) -ジメチルアンモニウム 硫酸塩の合成

ジメチルジチオカルバミン酸ナトリウム 2 水和物 7.93 g (44.33 mmol) をアセトニトリル 80 ml に懸濁し、これに 2-ブロモ-1- (2, 6-ジフルオロフェニル) -プロパン-1-オン 10.03 g (40.3 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。引き続き、残渣に濃硫酸 13 ml を加え室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチル 1.5 l を注ぎ、析出した結晶をろ取することにより、(4- (2, 6-ジフルオロフェニル) -5-メチル- [1, 3] ジチオール-2-イリデン) -ジメチルアンモニウム 硫酸塩 10 g を無色結晶として得た。

〔参考例 23〕

4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 3-ジチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 硫酸塩の合成

50% ジメチルアミン水溶液 1.35 g (15 mmol) をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解し、次いで二硫化炭素 0.57 g (7.5 mmol) を加え室温にて 1 時間攪拌した。さらに 2-ブロモ-1- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1-エタノン 2 g (7.49 mmol) を加え引き続き 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、析出した結晶を水洗後、酢酸エチルに溶解した。酢酸エチル溶液を食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶

媒を留去した。得られた残渣に、0℃にて濃硫酸4mlを加え10分間攪拌した後、酢酸エチルを注いだ。析出した結晶をろ取することにより、目的の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,3-ジチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 硫酸塩1.1gを無色結晶として得た。

〔参考例24〕

(4-(4-メチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩の合成

テトラメチルチオウレア13.2g(0.1mol)をジオキサン300mlに溶解し、次いで2-ブロモ-1-(4-メチルフェニル)-プロパン-1-オン22.7g(0.1mol)を加え、還流下10分間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、析出した結晶をろ取することにより、目的の(4-(4-メチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩21gを無色結晶として得た。

同様に、2-ブロモ-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-プロパン-1-オンを原料として用いることで、(4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩を無色結晶として得た。

〔参考例25〕

2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ニトロベンゼンの合成

2-ニトロアニリン10g(72.4mmol)を酢酸エチル150mlに溶解し、氷浴にて冷却した。これに、チオホスゲン6.62ml(86.9mmol)を加え、還流下4分間攪拌した。反応混合物を氷浴にて冷却し、50%ジメチルアミン水溶液65.2g(724mmol)を内温が7~13℃になるように加え、さらに室温にて16分間攪拌した。反応混合物に水10mlを加えた後、氷浴にて冷却しながら濃塩酸を加え酸性とし、次いで、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的の2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ニトロベンゼン14gを無色結晶として得た。

融点：95－97℃

同様に、原料として2-ヨードアニリンを用いることで、2-((ジメチルアミノ)チオキシメチル)アミノ)ヨードベンゼンを得た。

融点：153－154℃

〔参考例26〕

メチル (メトキシメチル(2-((ジメチルアミノ)チオキシメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)カルバミン酸の合成

トリホスゲン2.93g(9.4mmol)をトルエン10mlに溶解し、氷浴にて冷却した。これに2-メチル-6-ニトロアニリン3g(19.7mmol)のトルエン15ml溶液を加え4時間加熱還流した。常圧にて、トルエンを留去し得られた残渣にメタノール20mlを加えた。次いでピリジン3滴およびトリエチルアミン2mlを加え、3時間加熱還流した。反応混合物に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に酢酸エチルを加え、水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル 6-メチルフェニルカルバミン酸2.67gを得た。引き続き得られたメチル 6-メチルフェニルカルバミン酸2.67g(12.7mmol)をテトラヒドロフラン44mlに溶解し、水酸化カリウム1.68g(25.4mmol)、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド0.29g(1.3mmol)およびクロロメチルメチルエーテル1.74g(21.6mmol)を加え室温にて30分間攪拌した。次いで水酸化カリウムおよびクロロメチルメチルエーテルそれぞれ0.7gを加えさらに30分攪拌した。不溶物をろ別し、ろ液に酢酸エチルおよび水を加え、分液した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル メトキシメチル(6-メチルフェニル)カルバミン酸3.2gを得た。引き続き得られたメチル メトキシメチル(6-メチルフェニル)カルバミン酸1.5gを酢酸エチル15mlに溶解し、これに5%パラジウム-活性炭0.15gを加えた。水素雰囲気下室温にて2時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過により不溶物をろ別した。ろ液にトリエチルアミン1.79g(17.7mmol)を加え、次

いで氷冷下、チオホスゲン 0.54 ml (7.1 mmol) を加えた後、室温にて 30 分間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50%ジメチルアミン水溶液 1.06 g (11.8 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 30 分間攪拌した後、水および飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のメチル (メトキシメチル (2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)カルバミン酸 1.68 g を無色結晶として得た。

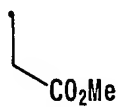
〔参考例 27〕

2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ヨードベンゼンの合成

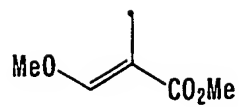
2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ヨードベンゼン 1.2 g (3.9 mmol) を 20 ml の N,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 1.12 g (3.9 mmol) を加えた。60℃にて 2 時間攪拌を行った後、さらに 90℃にて 2 時間攪拌を行った。反応混合物を酢酸エチルに溶解し、水および食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)にて精製することにより目的の 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ヨードベンゼン 1.8 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.5} 1.5934$

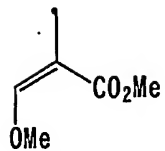
次にこれらの方法に準じて製造した一般式(1)の化合物の物性値等を第8表から第20表に示す。なお、表中の略号は前述の通りであり、T1からT33およびHet1からHet48は以下のものを表す。



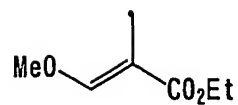
T1:



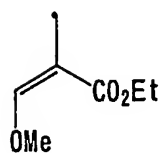
T2-1:



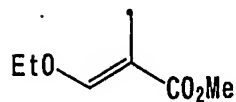
T2-2:



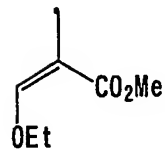
T3-1:



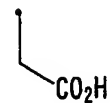
T3-2:



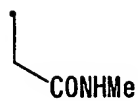
T4-1:



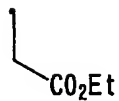
T4-2:



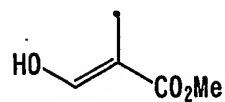
T5:



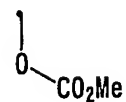
T6:



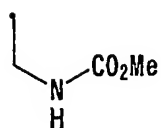
T7:



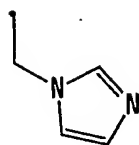
T8:



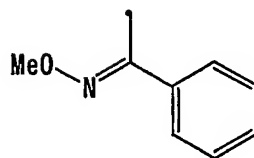
T9:



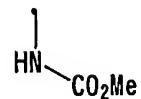
T10:



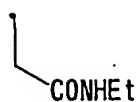
T11:



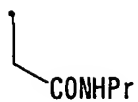
T12:



T13:



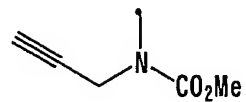
T14:



T15:



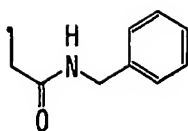
T16:



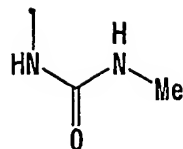
T17:



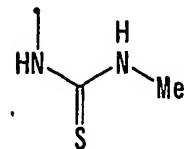
T18:



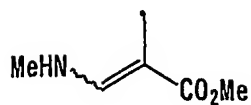
T19:



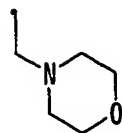
T20:



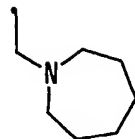
T21:



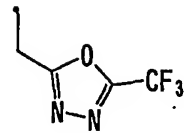
T22:



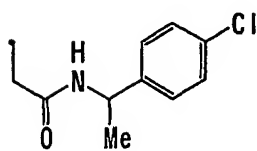
T23:



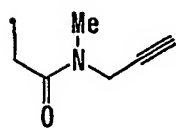
T24:



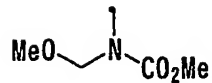
T25:



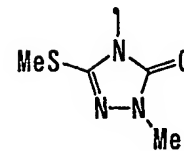
T26:



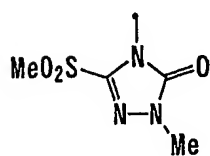
T27:



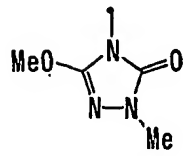
T28:



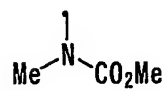
T29:



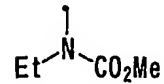
T30:



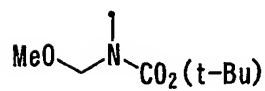
T31:



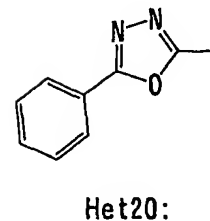
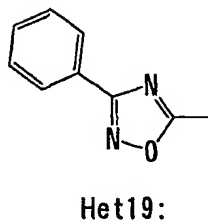
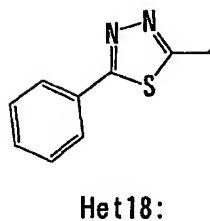
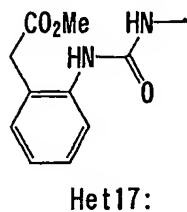
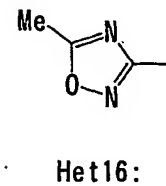
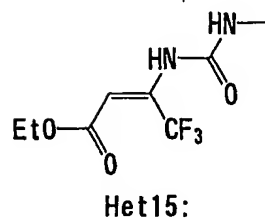
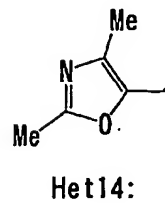
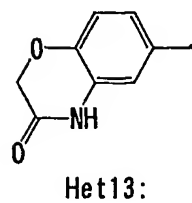
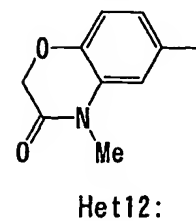
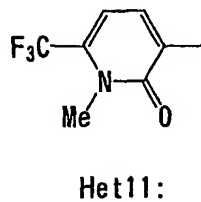
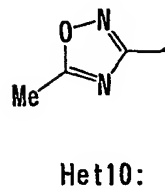
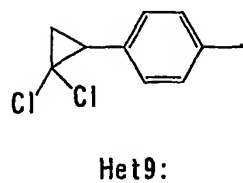
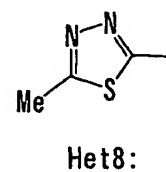
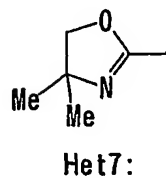
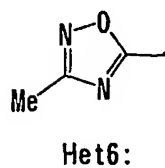
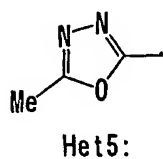
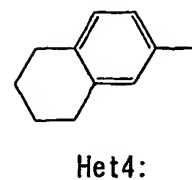
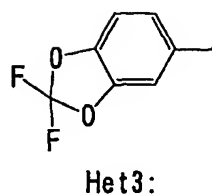
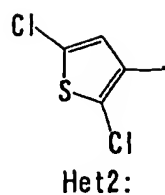
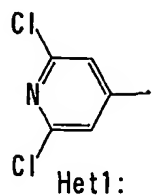
T32:

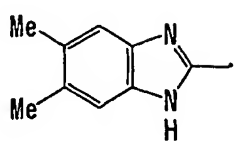


T33:

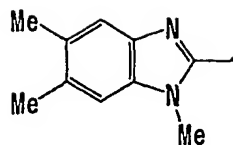


T34:

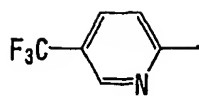




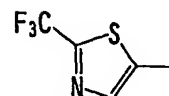
Het21:



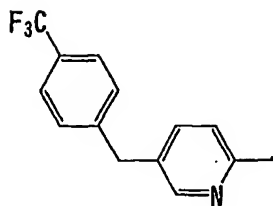
Het22:



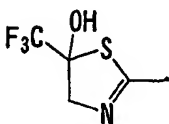
Het23:



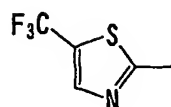
Het24:



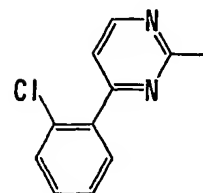
Het25:



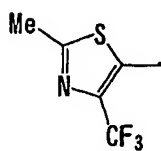
Het26:



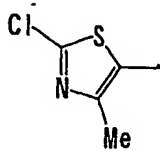
Het27:



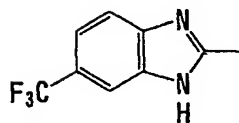
Het28:



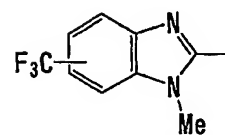
Het29:



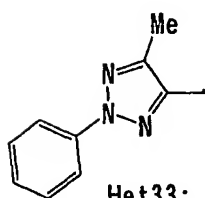
Het30:



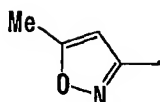
Het31:



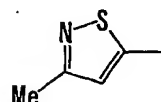
Het32:



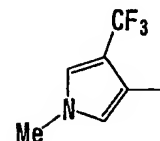
Het33:



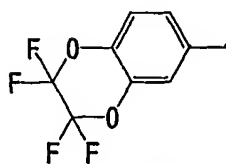
Het34:



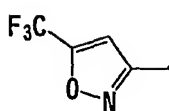
Het35:



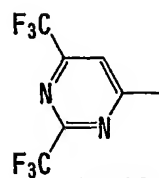
Het36:



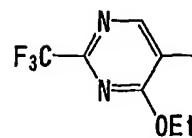
Het37:



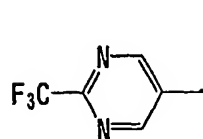
Het38:



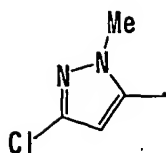
Het39:



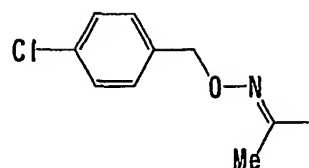
Het40:



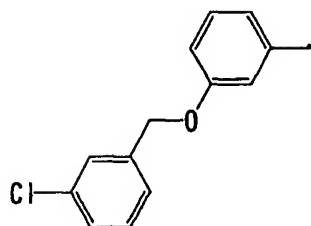
Het41:



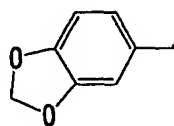
Het42:



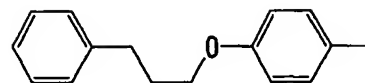
Het43:



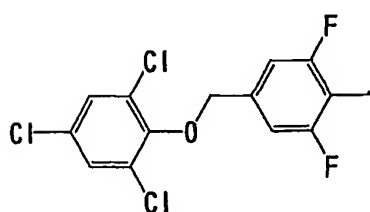
Het44:



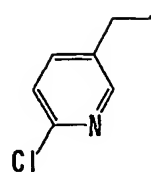
Het45:



Het46:

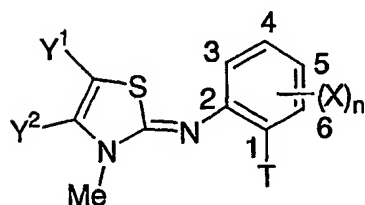


Het47:



Het48:

〔第 8 表〕



| No. | Y ¹ | Y ² | T | X | 物性(m. p. 等) | 備考 |
|-----|----------------|----------------|----|---|--|----|
| I-1 | H | Ph | T1 | H | n _D ²¹ . 51.5600 | |
| I-2 | H | 2-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 112-113°C | |
| I-3 | H | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D ²² . 11.4906 | |
| I-4 | H | 4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 73-74°C | |
| I-5 | H | 2-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 86-89°C | |
| I-6 | H | 3-MeO-Ph | T1 | H | n _D ²¹ . 31.4859 | |
| I-7 | H | 4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 82-83°C | |
| I-8 | H | 2-Me-Ph | T1 | H | m. p. 110-112°C | |

| | | | | | |
|------|------|-----------------------|--------------|---|----------------------------|
| I-9 | H | 3-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 51.5391 |
| I-10 | H | 4-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 21.5282 |
| I-11 | H | 2-F-Ph | T1 | H | m.p. 102.5-104.5°C |
| I-12 | H | 3-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 51.5762 |
| I-13 | H | 4-F-Ph | T1 | H | m.p. 75-76°C |
| I-14 | H | 4-NO ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 125-127°C |
| I-15 | H | 4-Ph-Ph | T1 | H | n _D 22. 11.5154 |
| I-16 | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 91.5115 |
| I-17 | H | 3-CN-Ph | T1 | H | m.p. 137-141°C |
| I-18 | H | 2-Naphthyl | T1 | H | m.p. 95-96°C |
| I-19 | H | 2-Thienyl | T1 | H | n _D 21. 81.4598 |
| I-20 | H | 2-Furyl | T1 | H | n _D 21. 81.5382 |
| I-21 | H | 3-Pyridyl | T1 | H | m.p. 85-87°C |
| I-22 | H | H | T1 | H | n _D 20. 21.5187 |
| I-23 | H | Me | T1 | H | n _D 20. 21.5172 |
| I-24 | H | MeOC(=O) | T1 | H | n _D 20. 21.5393 |
| I-25 | H | t-Bu | T1 | H | n _D 21. 81.4629 |
| I-26 | H | MeC(=NOMe)- | T1 | H | m.p. 48-50°C |
| I-27 | H | Et | T1 | H | n _D 21. 61.6100 |
| I-28 | H | i-Pr | T1 | H | n _D 21. 61.5982 |
| I-29 | H | CF ₃ | T1 | H | n _D 21. 71.5528 |
| I-30 | H | ClCH ₂ | T1 | H | n _D 21. 81.6074 |
| I-31 | H | MeSCH ₂ | T1 | H | n _D 21. 11.6315 |
| I-32 | MeCO | Me | T1 | H | n _D 20. 21.5126 |
| I-33 | Me | Me | T1 | H | n _D 21. 71.6084 |
| I-34 | H | Ph | T5 | H | m.p. 143-144°C |
| I-35 | H | Ph | T6 | H | m.p. 123-125°C |
| I-36 | H | Ph | T7 | H | n _D 20. 01.4620 |
| I-37 | H | Ph | T2-1 | H | m.p. 118-120°C |
| I-38 | H | Ph | T2-2 | H | m.p. 141-143°C |
| I-39 | H | Ph | T3-1 | H | n _D 22. 01.4908 |
| I-40 | H | Ph | T3-2 | H | n _D 22. 01.5098 |
| I-41 | H | Ph | T4-1 | H | n _D 22. 01.5902 |
| I-42 | H | Ph | T4-2 | H | n _D 22. 01.5005 |
| I-43 | H | 2-Cl-Ph | T2-1 | H | m.p. 166-167°C |
| I-44 | H | 2-Cl-Ph | T2-2 | H | m.p. 133-134°C |
| I-45 | H | 3-Cl-Ph | T2-1 | H | m.p. 115-116°C |
| I-46 | H | 3-Cl-Ph | T2-2 | H | m.p. 133-134°C |
| I-47 | H | 4-Cl-Ph | T2-1 | H | m.p. 154-156°C |
| I-48 | H | 4-Cl-Ph | T2-2 | H | m.p. 136-138°C |
| I-49 | H | 4-MeO-Ph | T2-1, 2mixt. | H | m.p. 151-153°C |
| I-50 | H | 4-Me-Ph | T2-1 | H | 粘稠油状物 |
| I-51 | H | 4-Me-Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-52 | H | 4-F-Ph | T2-1 | H | 粘稠油状物 |
| I-53 | H | 4-F-Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-54 | H | 4-Ph-Ph | T2-1 | H | m.p. 71-75°C |
| I-55 | H | 4-CF ₃ -Ph | T2-1 | H | m.p. 169-171°C |
| I-56 | H | 4-CF ₃ -Ph | T2-2 | H | m.p. 131-132°C |
| I-57 | H | 2-Naphthyl | T2-1 | H | m.p. 136-138°C |
| I-58 | H | 2-Naphthyl | T2-2 | H | 油状物 |
| I-59 | H | 2-Thienyl | T2-1 | H | 油状物 |
| I-60 | H | H | T2-1 | H | m.p. 115-117°C |
| I-61 | H | H | T2-2 | H | m.p. 109-111°C |
| I-62 | H | Me | T2-1 | H | m.p. 122-123°C |
| I-63 | H | Me | T2-2 | H | m.p. 108-109°C |
| I-64 | H | t-Bu | T2-1 | H | m.p. 120-121°C |
| I-65 | H | t-Bu | T2-2 | H | m.p. 118-120°C |
| I-66 | H | MeC(=NOMe)- | T2-1 | H | n _D 21. 91.4912 |

| | | | | | |
|-------|----------------------------------|---------------------------|------|---|---------------------------|
| I-67 | H | MeC(=NOMe)- | T2-2 | H | n _D 22.01.4876 |
| I-68 | H | Et | T2-1 | H | m.p. 78-80°C |
| I-69 | H | Et | T2-2 | H | n _D 21.51.6154 |
| I-70 | H | i-Pr | T2-1 | H | n _D 21.71.5772 |
| I-71 | H | i-Pr | T2-2 | H | m.p. 104-106°C |
| I-72 | H | CF ₃ | T2-1 | H | n _D 21.31.5638 |
| I-73 | H | CF ₃ | T2-2 | H | n _D 21.81.5507 |
| I-74 | Me | H | T2-1 | H | m.p. 100-101°C |
| I-75 | Me | H | T2-2 | H | m.p. 125-127°C |
| I-76 | Me | Me | T2-1 | H | m.p. 162-163°C |
| I-77 | Me | Me | T2-2 | H | m.p. 148-152°C |
| I-78 | H | 2-Thiazolyl | T1 | H | m.p. 93-94°C |
| I-79 | H | 2,3-Cl ₂ -Ph | T1 | H | 粘稠油状物 |
| I-80 | H | 3,5-Cl ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21.31.4874 |
| I-81 | H | 2,6-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 126-128°C |
| I-82 | H | 2,5-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 92-93.5°C |
| I-83 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 116.5-117.5°C |
| I-84 | H | 3,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21.21.5676 |
| I-85 | H | 2,3-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 60-61°C |
| I-86 | H | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21.01.5595 |
| I-87 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 137.5-138.5°C |
| I-88 | H | 2,5-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 95-96°C |
| I-89 | H | 2,4-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 96-98°C |
| I-90 | H | 2-Pyrazyl | T1 | H | m.p. 84-86°C |
| I-91 | H | 2-Benzofuranyl | T1 | H | n _D 20.51.5170 |
| I-92 | H | 4-Br-Ph | T1 | H | m.p. 120-122°C |
| I-93 | H | 4-Et-Ph | T1 | H | n _D 20.71.5065 |
| I-94 | H | 4-PhO-Ph | T1 | H | n _D 20.71.4881 |
| I-95 | H | 2-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 20.61.5355 |
| I-96 | H | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | n _D 21.31.5178 |
| I-97 | H | 2-F-6-CF ₃ -Ph | T1 | H | m.p. 99.5-101°C |
| I-98 | H | Het43 | T1 | H | n _D 21.41.5141 |
| I-99 | H | Het42 | T1 | H | m.p. 89-91°C |
| I-100 | Cl | Ph | T1 | H | n _D 21.51.5748 |
| I-101 | Ph | Ph | T1 | H | m.p. 116-118°C |
| I-102 | Me | Ph | T1 | H | m.p. 89-91°C |
| I-103 | Me ₂ NCH ₂ | Ph | T1 | H | n _D 21.31.4743 |
| I-104 | H | 2-Cl-Ph | T8 | H | m.p. 143-144°C |
| I-105 | H | 2-MeO-Ph | T2-1 | H | m.p. 130-131°C |
| I-106 | H | 2-MeO-Ph | T2-2 | H | m.p. 129-131.5°C |
| I-107 | H | 3-MeO-Ph | T2-1 | H | m.p. 127-130°C |
| I-108 | H | 3-MeO-Ph | T2-2 | H | m.p. 109-113°C |
| I-109 | H | 2-Me-Ph | T2-1 | H | m.p. 111-113°C |
| I-110 | H | 2-Me-Ph | T2-2 | H | m.p. 139.5-142°C |
| I-111 | H | 3-Me-Ph | T2-1 | H | m.p. 117.5-119°C |
| I-112 | H | 3-Me-Ph | T2-2 | H | m.p. 129-131°C |
| I-113 | H | 2-F-Ph | T2-1 | H | m.p. 111-111.5°C |
| I-114 | H | 2-F-Ph | T2-2 | H | m.p. 128-129°C |
| I-115 | H | 3-F-Ph | T2-1 | H | m.p. 137-138°C |
| I-116 | H | 3-F-Ph | T2-2 | H | m.p. 136-139°C |
| I-117 | H | 4-PhO-Ph | T2-1 | H | m.p. 132.5-134.5°C |
| I-118 | H | 4-PhO-Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-119 | H | 4-Br-Ph | T2-1 | H | m.p. 179-180.5°C |
| I-120 | H | 4-Et-Ph | T2-1 | H | m.p. 93-95°C |
| I-121 | H | 3-Pyridyl | T2-1 | H | m.p. 125-128°C |
| I-122 | H | 3-Pyridyl | T2-2 | H | m.p. 122-125.5°C |
| I-123 | H | 2-Furyl | T2-1 | H | 粘稠油状物 |
| I-124 | H | 2-Thiazolyl | T2-1 | H | 粘稠油状物 |

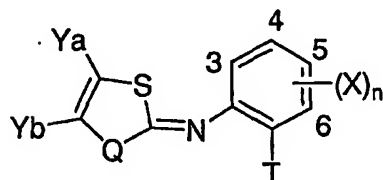
| | | | | | |
|-------|-------------|---|------|---|----------------------------|
| I-125 | H | 2-CF ₃ -Ph | T2-1 | H | m. p. 150-151°C |
| I-126 | H | Het44 | T2-1 | H | m. p. 91-94°C |
| I-127 | H | 2,3-Cl ₂ -Ph | T2-1 | H | m. p. 176-178°C |
| I-128 | H | 2,3-Cl ₂ -Ph | T2-2 | H | m. p. 130-131°C |
| I-129 | H | 3,5-Cl ₂ -Ph | T2-1 | H | 粘稠油状物 |
| I-130 | H | 3,5-Cl ₂ -Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-131 | H | 2,6-Cl ₂ -Ph | T2-1 | H | m. p. 165-169°C |
| I-132 | H | 2,6-Cl ₂ -Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-133 | H | 2,5-Cl ₂ -Ph | T2-1 | H | m. p. 173-175°C |
| I-134 | H | 2,5-Cl ₂ -Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-135 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T2-1 | H | m. p. 136-139°C |
| I-136 | H | 2-F-6-MeO-Ph | T2-1 | H | m. p. 145-148°C |
| I-137 | Cl | Ph | T2-1 | H | m. p. 132-134°C |
| I-138 | Cl | Ph | T2-2 | H | 粘稠油状物 |
| I-139 | Me | Ph | T2-1 | H | m. p. 151.5-153°C |
| I-140 | Me | Ph | T2-2 | H | m. p. 127.5-129°C |
| I-141 | Ph | Ph | T2-1 | H | m. p. 134.5-136.5°C |
| I-142 | Ph | Ph | T2-2 | H | m. p. 180-182°C |
| I-143 | H | Bu | T1 | H | n _D 21. 51.5947 |
| I-144 | H | i-Bu | T1 | H | n _D 21. 51.5882 |
| I-145 | H | s-Bu | T1 | H | n _D 21. 51.5916 |
| I-146 | H | Hex | T1 | H | n _D 21. 51.5799 |
| I-147 | H | c-Hex | T1 | H | n _D 21. 51.5872 |
| I-148 | H | C ₂ F ₅ | T1 | H | n _D 21. 51.5290 |
| I-149 | H | (2,4-Cl ₂ -PhO)CH ₂ | T1 | H | m. p. 104-105°C |
| I-150 | H | Pyrrolidino-CH ₂ | T1 | H | m. p. 82-84°C |
| I-151 | H | PhC(CF ₃)=N-OCH ₂ | T1 | H | n _D 20. 51.5817 |
| I-152 | H | PhN(Me)CH ₂ | T1 | H | 油状物 |
| I-153 | H | PhCH=CH | T1 | H | 油状物 |
| I-154 | H | Ph ₃ PCH ₂ | T1 | H | m. p. 170°C < Cl 塩 |
| I-155 | H | Het43 | T1 | H | n _D 20. 71.6177 |
| I-156 | 2-F-Ph | Me | T1 | H | m. p. 66-71°C |
| I-157 | Ph | Me | T1 | H | m. p. 107-109°C |
| I-158 | Ph | Et | T1 | H | m. p. 91-94°C |
| I-159 | Me (MeON=)C | Me | T1 | H | m. p. 99-100°C |
| I-160 | H | Bu | T2-1 | H | m. p. 111-112°C |
| I-161 | H | Bu | T2-2 | H | 油状物 |
| I-162 | H | i-Bu | T2-1 | H | n _D 20. 51.5966 |
| I-163 | H | i-Bu | T2-2 | H | m. p. 105-107°C |
| I-164 | H | s-Bu | T2-1 | H | n _D 20. 51.6004 |
| I-165 | H | s-Bu | T2-2 | H | n _D 20. 51.5943 |
| I-166 | H | Hex | T2-1 | H | m. p. 79-82°C |
| I-167 | H | Hex | T2-2 | H | m. p. 56-58°C |
| I-168 | H | C ₂ F ₅ | T2-1 | H | 油状物 |
| I-169 | H | C ₂ F ₅ | T2-2 | H | 油状物 |
| I-170 | H | 2,4-Cl ₂ -PhOCH ₂ | T2-1 | H | m. p. 191-193°C |
| I-171 | H | 2,4-Cl ₂ -PhOCH ₂ | T2-2 | H | 油状物 |
| I-172 | H | Pyrrolidino-CH ₂ | T2-1 | H | m. p. 151-154°C |
| I-173 | H | PhC(CF ₃)=N-OCH ₂ | T2-1 | H | 油状物 |
| I-174 | H | PhC(CF ₃)=N-OCH ₂ | T2-2 | H | 油状物 |
| I-175 | H | PhN(Me)CH ₂ | T2-1 | H | 油状物 |
| I-176 | H | PhN(Me)CH ₂ | T2-2 | H | 油状物 |
| I-177 | H | Het43 | T2-1 | H | 油状物 |
| I-178 | H | Het43 | T2-2 | H | 油状物 |
| I-179 | H | c-Pr | T2-1 | H | 油状物 |
| I-180 | H | c-Pr | T2-2 | H | m. p. 101-104°C |
| I-181 | H | MeSCH ₂ | T2-1 | H | 油状物 |
| I-182 | H | MeSCH ₂ | T2-2 | H | m. p. 144-148°C |

| | | | | | |
|-------|-------------------|----------------------------------|------|-------------------|--|
| I-183 | 2-F-Ph | Me | T2-1 | H | 油状物 |
| I-184 | 2-F-Ph | Me | T2-2 | H | 油状物 |
| I-185 | Ph | Et | T2-1 | H | m. p. 175-177°C |
| I-186 | Ph | Et | T2-2 | H | m. p. 126-129°C |
| I-187 | H | Ph | T1 | 4-F | m. p. 74-76°C |
| I-188 | H | Ph | T1 | 4-Me | m. p. 108-110°C |
| I-189 | H | Ph | T1 | 5-Me | m. p. 105-107°C |
| I-190 | H | Ph | T1 | 4-Cl | 油状物 |
| I-191 | H | Ph | T1 | 5-Cl | m. p. 57-58°C |
| I-192 | H | Ph | T1 | 4-CF ₃ | m. p. 150-160°C HBr塩 |
| I-193 | H | 2, 6-F ₂ -Ph | T1 | 4-F | m. p. 128-129°C |
| I-194 | H | Ph | T1 | 4-MeO | m. p. 72-73°C |
| I-195 | H | Ph | T1 | 4-MeO | m. p. 176-184°C HBr塩 |
| I-196 | H | 2-Me-Ph | T1 | H | m. p. 205-211°C HBr塩 |
| I-197 | H | 2-F-Ph | T1 | H | m. p. 191-197°C HBr塩 |
| I-198 | H | i-Pr | T1 | H | m. p. 212-217°C HBr塩 |
| I-199 | H | 2-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 210°C<分解 HBr塩 |
| I-200 | H | c-Hex | T1 | H | m. p. 208-211°C HBr塩 |
| I-201 | H | c-Pr | T1 | H | m. p. 172-174°C HBr塩 |
| I-202 | BrCH ₂ | H | T1 | H | m. p. 180-183°C HBr塩 |
| I-203 | H | 3, 5-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D ₂₀ 1.31.5882 |
| I-204 | H | 2, 6-F ₂ -Ph | T5 | H | m. p. 172-174°C |
| I-205 | H | 2, 6-F ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 123-126°C |
| I-206 | H | 2-Pyridyl | T1 | H | m. p. 98-99.5°C |
| I-207 | H | 1-Naphthyl | T1 | H | m. p. 121-122°C |
| I-208 | H | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | m. p. 129-131°C |
| I-209 | H | PhCO | T1 | H | n _D ₂₅ 1.5727 |
| I-210 | H | 2, 3, 4, 5, 6-F ₅ -Ph | T1 | H | m. p. 129-131°C |
| I-211 | H | 2-F-6-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 92-93°C |
| I-212 | H | Ph | T1 | 3-F | m. p. 69-70°C |
| I-213 | H | MeO ₂ C-(MeON)=C | T1 | H | m. p. 111-112°C |
| I-214 | H | Ph-(HON)=C | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5154 |
| I-215 | H | Ph-(MeON)=C | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5239 |
| I-216 | H | Ph-(PhCH ₂ ON)=C | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5953 |
| I-217 | F | Ph | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5117 |
| I-218 | H | 2-F-6-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 112-114°C |
| I-219 | H | Het11 | T1 | H | m. p. 115-116.5°C |
| I-220 | H | 2-F-4-F ₃ C-Ph | T1 | H | m. p. 71-72°C |
| I-221 | H | 2-O ₂ N-Ph | T1 | H | m. p. 107.5-109°C |
| I-222 | H | 2, 6-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 133.5-134°C |
| I-223 | H | 2, 5-F ₂ -4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 117-119°C |
| I-224 | H | 4, 6-Cl ₂ -2-Pyridyl | T1 | H | 粘稠油状物 |
| I-225 | H | 2, 5-Cl ₂ -3-Thienyl | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5356 |
| I-226 | H | 2, 5-Me ₂ -Ph | T1 | H | n _D ₂₁ 1.5582 |
| I-227 | H | 2-(PhCH ₂ O)-Ph | T1 | H | m. p. 83-84.5°C |
| I-228 | H | Het45 | T1 | H | m. p. 69-70.5°C |
| I-229 | H | Ph-C(Br)=C(Br) | T1 | H | 粘稠油状物 |
| I-230 | H | 2-Cl-Ph | T5 | H | m. p. 203-205°C |
| I-231 | H | FH ₂ C | T1 | H | 粘稠油状物 |
| I-232 | H | PhC≡C | T1 | H | m. p. 85-86°C |
| I-233 | B | Ph | T1 | H | n _D ₂₁ 1.6418 |
| I-234 | H | 3-Br-4-Me ₂ N-Ph | T1 | H | m. p. 106.5-108.5°C |
| I-235 | H | 2-HO-3, 4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 143-145°C |
| I-236 | H | 4-CN-Ph | T1 | H | m. p. 129-131°C |
| I-237 | H | 2, 6-Cl ₂ -4-Pyridyl | T1 | H | m. p. 157-159°C |
| I-238 | H | 4-MeOC(=O)-Ph | T1 | H | m. p. 104-106°C |
| I-239 | H | 4-Cl-Ph-C(Me) ₂ - | T1 | H | n _D ₂₀ 1.5361 |
| I-240 | H | Ph | T1 | 5-F | m. p. 105-106°C |

| | | | | | |
|-------|----|-------------------------------|----|---------------------|--------------------------|
| I-241 | H | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 100-101°C |
| I-242 | H | 4-n-Pr-Ph | T1 | H | m. p. 70-71°C |
| I-243 | H | 4-n-Bu-Ph | T1 | H | m. p. 43.5-44.5°C |
| I-244 | H | 2,3,6-F ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 83-84°C |
| I-245 | H | 4-MeS-Ph | T1 | H | m. p. 78-80°C |
| I-246 | H | 2-Br-Ph | T1 | H | m. p. 117-119°C |
| I-247 | H | 4-Hex-Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.5134 |
| I-248 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 116-117°C |
| I-249 | H | 4-Me-Ph | T1 | 6-Me | ρ_{D21}^{21} 1.4480 |
| I-250 | H | 3-F-4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 103.5-104.5°C |
| I-251 | H | 4-Me-Ph | T1 | 5-F | m. p. 123-124.5°C |
| I-252 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 5-F | m. p. 123-125°C |
| I-253 | H | 4-F ₂ HC-O-Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.5442 |
| I-254 | H | 4-I-Ph | T1 | H | m. p. 141-143°C |
| I-255 | H | Het 46 | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.5492 |
| I-256 | H | 2-F-4-EtO-Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.5406 |
| I-257 | H | 2-F-4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 80.5-82°C |
| I-258 | H | 2-F-4-Br-Ph | T1 | H | m. p. 62-63°C |
| I-259 | H | 2-F-6-I-Ph | T1 | H | m. p. 94-96°C |
| I-260 | H | 3-F-6-Me-Ph | T1 | H | m. p. 85.5-86.5°C |
| I-261 | Me | 4-F-Ph | T1 | H | m. p. 90.5-91.5°C |
| I-262 | H | 2-F-5-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 132-133°C |
| I-263 | H | 2-Me-3-F-Ph | T1 | H | m. p. 123.5-125°C |
| I-264 | H | 2,6-F ₂ -3-Me-Ph | T1 | H | m. p. 108-110°C |
| I-265 | H | 2-Cl-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 122-124°C |
| I-266 | H | 2-F-5-Me-Ph | T1 | H | m. p. 78.5-79.5°C |
| I-267 | H | 3-Cl-4-F-Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.5478 |
| I-268 | H | 3-F-4-Me-Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.4930 |
| I-269 | H | 2,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.4915 |
| I-270 | H | 2,3-F ₂ -4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 70.5-71.5°C |
| I-271 | H | 2,3-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 93.5-95°C |
| I-272 | H | 3,5-Me ₂ -Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.5326 |
| I-273 | H | 3-Me-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 83.5-84.5°C |
| I-274 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 97-98°C |
| I-275 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | ρ_{D21}^{21} 1.5495 |
| I-276 | H | 2-F-4-MeO-Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.5922 |
| I-277 | H | 2-Me-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 101-103°C |
| I-278 | H | 3-Me-4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 78.5-80°C |
| I-279 | H | 2-F-4-Cl-5-Me-Ph | T1 | H | m. p. 80.5-81.5°C |
| I-280 | H | 2-MeO-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 149-151°C |
| I-281 | H | 2-F-4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 69-71°C |
| I-282 | H | 4-(Ph-C≡C)-Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.5366 |
| I-283 | H | 4-(MeC(O))-Ph | T1 | H | m. p. 93-95°C |
| I-284 | H | 2-MeO-4-MeS-Ph | T1 | H | m. p. 150.5-152.5°C |
| I-285 | H | 2-(Me ₃ Si-C≡C)-Ph | T1 | H | ρ_{D20}^{20} 1.4962 |
| I-286 | H | 4-(PhC(O))-Ph | T1 | H | oil |
| I-287 | H | 2-F-5-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 134-135°C |
| I-288 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-t-Bu | m. p. 148-150°C |
| I-289 | H | Het 47 | T1 | H | m. p. 123-124°C |
| I-290 | H | 2,6-F ₂ -4-Oct-Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.5030 |
| I-291 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-PhCH ₂ | m. p. 117-118°C |
| I-292 | H | 2,6-F ₂ -4-Me-Ph | T1 | H | ρ_{D26}^{26} 1.5472 |
| I-293 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-MeO | m. p. 105-106°C |
| I-294 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Et | m. p. 67-68°C |
| I-295 | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 118.4-119°C |
| I-296 | H | 2-F-4-PrO-Ph | T1 | H | ρ_{D21}^{21} 1.5193 |
| I-297 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 6-MeO | m. p. 139-140°C |
| I-298 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Pr | ρ_{D21}^{21} 1.5966 |

| | | | | | |
|-------|----------|------------------------------|-----|--------|---------------------------|
| I-299 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 5-Me | m. p. 75-76°C |
| I-300 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Cl | m. p. 83-84°C |
| I-301 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 6-F | m. p. 143-146°C |
| I-302 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 5-MeO | m. p. 109-110°C |
| I-303 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 6-Cl | m. p. 122-122.5°C |
| I-304 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 5-Cl | m. p. 113.5-114.5°C |
| I-305 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Ph | m. p. 161.5-162.8°C |
| I-306 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-i-Pr | m. p. 106-108°C |
| I-307 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | 4-PhO | m. p. 139-140°C |
| I-308 | Ph | H | T1 | H | m. p. 49-50°C |
| I-309 | H | 5-CF ₃ -2-pyridyl | T1 | H | m. p. 106-107°C |
| I-310 | H | 5-CF ₃ -2-pyridyl | T1 | 4-Me | m. p. 107-109°C |
| I-311 | H | 5-CF ₃ -2-pyridyl | T1 | 4-Et | n _D 21.31.5782 |
| I-312 | 2-Cl-Ph | Me | T1 | H | n _D 20.31.6253 |
| I-313 | H | 2-Cl-PhCH ₂ | T1 | H | n _D 20.71.6178 |
| I-314 | 2-MeO-Ph | Me | T1 | H | n _D 20.71.5432 |
| I-315 | Het45 | Me | T1 | H | n _D 20.91.5486 |
| I-316 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T13 | H | m. p. 125-128°C |

〔第9表〕



| No. | Q | Ya | Yb | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|-------|---|----|------------------------|----|-----|---------------------------|
| II-1 | 0 | H | Ph | T1 | H | m. p. 67-69°C |
| II-2 | 0 | H | 2-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 86-87°C |
| II-3 | 0 | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 79-81°C |
| II-4 | 0 | H | 4-Br-Ph | T1 | H | oil |
| II-5 | 0 | H | 2-MeO-Ph | T1 | H | n _D 21.71.5262 |
| II-6 | 0 | H | 3-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 111-112°C |
| II-7 | 0 | H | 4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 78-79°C |
| II-8 | 0 | H | 3-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 110-111°C |
| II-9 | S | H | Ph | T1 | H | oil |
| II-10 | 0 | H | 4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 99-100°C |
| II-11 | 0 | H | 2-F-Ph | T1 | H | m. p. 62-63°C |
| II-12 | 0 | H | 3-F-Ph | T1 | H | m. p. 85-86°C |
| II-13 | 0 | H | 4-F-Ph | T1 | H | m. p. 90-91°C |
| II-14 | 0 | H | 2-Me-Ph | T1 | H | m. p. 78-79°C |
| II-15 | 0 | H | 3-Me-Ph | T1 | H | m. p. 77-79°C |
| II-16 | 0 | H | 4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 59-60°C |
| II-17 | 0 | H | 2-MeO-Ph | T1 | 4-F | n _D 21.31.5304 |
| II-18 | 0 | H | 2,5-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 97-98°C |
| II-19 | 0 | H | 1-Naphthyl | T1 | H | oil |
| II-20 | 0 | H | i-Bu | T1 | H | n _D 20.91.5630 |
| II-21 | 0 | H | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 106-107°C |
| II-22 | 0 | H | 4-NO ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 123-125°C |
| II-23 | 0 | H | 4-CN-Ph | T1 | H | m. p. 135-137°C |

| | | | | | | |
|-------|---|--------|-----------------------------|----|------|--------------------|
| II-24 | O | H | 2-Cl-Ph | T1 | 4-F | n_D^{20} 91.6218 |
| II-25 | S | H | 4-Br-Ph | T1 | H | m.p. 109-112°C |
| II-26 | S | H | 4-Me-Ph | T1 | H | n_D^{20} 91.5053 |
| II-27 | O | H | 2-Br-Ph | T1 | H | m.p. 74-75°C |
| II-28 | O | H | 4-MeS-Ph | T1 | H | m.p. 84-85°C |
| II-29 | S | H | 4-F-Ph | T1 | H | n_D^{20} 81.6054 |
| II-30 | O | H | 4-Et-Ph | T1 | H | n_D^{20} 71.6091 |
| II-31 | S | H | 4-MeO-Ph | T1 | H | m.p. 91-93°C |
| II-32 | S | H | 4-Cl-Ph | T1 | H | m.p. 98-101°C |
| II-33 | O | H | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | oil |
| II-34 | O | H | 2,6-Me ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{20} 51.5560 |
| II-35 | O | Me | Ph | T1 | H | n_D^{20} 41.5522 |
| II-36 | S | H | 2-F-Ph | T1 | H | n_D^{20} 71.6589 |
| II-37 | S | H | 2-Me-Ph | T1 | H | n_D^{21} 11.6505 |
| II-38 | O | H | 4-PhO-Ph | T1 | H | oil |
| II-39 | O | H | 4-Hex-Ph | T1 | H | m.p. 72-73°C |
| II-40 | O | H | 4-Bu-Ph | T1 | H | n_D^{20} 41.5584 |
| II-41 | O | H | 4-Pr-Ph | T1 | H | n_D^{20} 41.5356 |
| II-42 | O | H | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | n_D^{21} 51.5528 |
| II-43 | S | H | 2-Cl-Ph | T1 | H | n_D^{20} 11.6604 |
| II-44 | S | H | 2-Br-Ph | T1 | H | n_D^{20} 81.6644 |
| II-45 | O | H | 2,4-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 100-101°C |
| II-46 | O | H | 2-F-6-Cl-Ph | T1 | H | m.p. 87-88°C |
| II-47 | O | H | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | m.p. 79-80°C |
| II-48 | O | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m.p. 91-92°C |
| II-49 | S | H | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{21} 61.6391 |
| II-50 | S | H | 2,5-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{21} 11.6465 |
| II-51 | S | H | 2,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{21} 91.6421 |
| II-52 | S | H | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{22} 01.6375 |
| II-53 | S | Me | Ph | T1 | H | n_D^{21} 91.6470 |
| II-54 | O | Br | Ph | T1 | H | oil |
| II-55 | O | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 65-66°C |
| II-56 | O | H | 2,5-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 128-129°C |
| II-57 | O | H | 3,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 115-116°C |
| II-58 | S | H | 2,3-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 52-53°C |
| II-59 | O | Me | 4-F-Ph | T1 | H | m.p. 60-62°C |
| II-60 | O | Et | Ph | T1 | H | m.p. 68-69°C |
| II-61 | O | H | 2,3-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 88-89°C |
| II-62 | S | H | 2,5-Me ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{20} 01.6480 |
| II-63 | S | Ph | Ph | T1 | H | oil |
| II-64 | O | H | 2,5-Me ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 80-82°C |
| II-65 | O | H | 2-F-4-Cl-Ph | T1 | H | m.p. 85-87°C |
| II-66 | O | Me | 2,5-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{21} 21.6532 |
| II-67 | O | H | 4-i-Pr-Ph | T1 | H | m.p. 83-85°C |
| II-68 | O | H | 4-F-3-Cl-Ph | T1 | H | m.p. 117-118°C |
| II-69 | O | H | 2-F-4-EtO-Ph | T1 | H | m.p. 101-103°C |
| II-70 | O | H | 2-Me-5-F-Ph | T1 | H | m.p. 55-56°C |
| II-71 | O | H | 3,5-F ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 138-139°C |
| II-72 | O | H | 3,5-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 84-85°C |
| II-73 | O | H | 3-F-4-MeO-Ph | T1 | H | n_D^{20} 21.6140 |
| II-74 | S | H | 2-Me-5-F-Ph | T1 | H | n_D^{20} 41.6382 |
| II-75 | S | Me | 4-F-Ph | T1 | H | n_D^{20} 21.6353 |
| II-76 | O | 4-F-Ph | Me | T1 | H | n_D^{21} 31.5963 |
| II-77 | O | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | n_D^{21} 21.5792 |
| II-78 | O | Me | 2-Cl-Ph | T1 | H | n_D^{21} 11.5571 |
| II-79 | O | H | 2,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | m.p. 55-57°C |
| II-80 | O | H | 2,6-F ₂ -3-Me-Ph | T1 | H | m.p. 88-89°C |
| II-81 | O | H | 2-Cl-4-F-Ph | T1 | H | m.p. 100-101°C |

| | | | | | | |
|--------|---|--------|-----------------------------|----|------|-----------------------------|
| II-82 | O | H | 2-F-5-Me-Ph | T1 | H | m. p. 70-71°C |
| II-83 | O | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 109-110°C |
| II-84 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 88-89°C |
| II-85 | S | H | 3,5-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6408 |
| II-86 | S | H | 2,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6401 |
| II-87 | S | H | 2-F-5-Me-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6442 |
| II-88 | S | Me | 4-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6273 |
| II-89 | O | H | 3-Me-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 83-84°C |
| II-90 | O | H | 2,3-F ₂ -4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 91-92°C |
| II-91 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 110-111°C |
| II-92 | O | H | 3-F-4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 77-78°C |
| II-93 | O | H | 2-Me-3-F-Ph | T1 | H | m. p. 64-65°C |
| II-94 | O | H | 3-Me-4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 109-110°C |
| II-95 | O | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 72-73°C |
| II-96 | O | H | 2-Me-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 88-89°C |
| II-97 | O | 2-F-Ph | Me | T1 | H | n _D 20. 41. 6095 |
| II-98 | O | H | 2-F-4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 91-92°C |
| II-99 | O | H | 2,3-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 78-80°C |
| II-100 | O | H | 3,5-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 88-91°C |
| II-101 | S | H | 2-Cl-4-F-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6421 |
| II-102 | S | H | 2-F-4-Cl-Ph | T1 | H | oil |
| II-103 | S | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6686 |
| II-104 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6179 |
| II-105 | S | Me | 2-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6375 |
| II-106 | O | H | 2-F-4-Cl-5-Me-Ph | T1 | H | m. p. 90-91°C |
| II-107 | S | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6191 |
| II-108 | S | H | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6132 |
| II-109 | S | H | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6054 |
| II-110 | S | H | 3-F-4-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6425 |
| II-111 | S | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 41. 5322 |
| II-112 | O | H | 2-F-4-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 4964 |
| II-113 | O | H | 2-MeO-4-MeS-Ph | T1 | H | m. p. 123-124°C |
| II-114 | O | H | 2-MeO-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 137-138°C |
| II-115 | S | Et | Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6435 |
| II-116 | S | H | 2-F-6-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6362 |
| II-117 | S | H | 2,3-Me ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6456 |
| II-118 | S | H | 1-naphthyl | T1 | H | oil |
| II-119 | S | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6199 |
| II-120 | O | Me | 2-F-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 5992 |
| II-121 | O | Et | 4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 98-99°C |
| II-122 | O | Pr | Ph | T1 | H | m. p. 65-66°C |
| II-123 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 67-68°C |
| II-124 | O | Me | 2-Et-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 6048 |
| II-125 | O | Me | 4-Br-Ph | T1 | H | m. p. 82-84°C |
| II-126 | O | Me | 2,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 5926 |
| II-127 | O | Me | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6292 |
| II-128 | O | Me | 3-Br-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 6363 |
| II-129 | O | H | 3,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 94-95°C |
| II-130 | O | Me | 4-Et-Ph | T1 | H | m. p. 82-84°C |
| II-131 | O | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | m. p. 74-76°C |
| II-132 | O | Me | 3,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 79-80°C |
| II-133 | O | Me | 4-Ph-Ph | T1 | H | m. p. 163-165°C |
| II-134 | O | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 116-119°C |
| II-135 | O | Me | 4-F-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 148-149°C |
| II-136 | O | H | Het1 | T1 | H | m. p. 126-128°C |
| II-137 | O | H | 2-Cl-4-F-Ph | T1 | H | m. p. 118-119°C |
| II-138 | O | H | 2-Me-3-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 91-92°C |
| II-139 | O | H | 2-Cl-4-Me-Ph | T1 | H | n _D 20. 41. 5477 |

| | | | | | | |
|--------|---|------|---------------------------|------|---------------------|----------------------------|
| II-140 | O | H | 3-Cl-4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 116-117°C |
| II-141 | O | H | 2-F-5-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 102-103°C |
| II-142 | O | Me | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | oil |
| II-143 | O | Et | 4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 113-115°C |
| II-144 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 5-F | m. p. 79-80°C |
| II-145 | O | Me | 4-F-Ph | T1 | 5-F | m. p. 19-20°C |
| II-146 | O | H | 2-Cl-5-Me-Ph | T1 | H | m. p. 78-79°C |
| II-147 | O | Me | 3-F-4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 20. 81.5646 |
| II-148 | O | Pr | 4-F-Ph | T1 | H | m. p. 62-63°C |
| II-149 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 77-79°C |
| II-150 | O | i-Pr | Ph | T1 | H | m. p. 76-77.5°C |
| II-151 | O | H | 3,4-(OH) ₂ -Ph | T1 | H | crystal |
| II-152 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-t-Bu | n _D 21. 81.5904 |
| II-153 | O | Pr | 4-Br-Ph | T1 | H | m. p. 80-81°C |
| II-154 | O | Bu | Ph | T1 | H | n _D 21. 11.5738 |
| II-155 | O | Me | 3-F-4-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 81.5094 |
| II-156 | S | Et | 4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 71-72°C |
| II-157 | O | Et | 4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 67-69°C |
| II-158 | O | Et | 4-Me-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 63-65°C |
| II-159 | O | Me | 4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 128-130°C |
| II-160 | O | Me | 4-MeO-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 119-120°C |
| II-161 | S | Me | 4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 69-71°C |
| II-162 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-t-Bu | n _D 21. 71.5959 |
| II-163 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-PhCH ₂ | n _D 21. 81.6288 |
| II-164 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-PhCH ₂ | n _D 21. 91.6295 |
| II-165 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-MeOC(O) | m. p. 112-114°C |
| II-166 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T2-1 | H | m. p. 145-147°C |
| II-167 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T5 | H | m. p. 127-128°C |
| II-168 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T7 | H | m. p. 61-63°C |
| II-169 | O | Et | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D 20. 21.4721 |
| II-170 | S | Me | 4-Br-Ph | T1 | H | n _D 21. 81.4429 |
| II-171 | S | Me | 3-Br-Ph | T1 | H | n _D 22. 01.4836 |
| II-172 | S | Me | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 81.4062 |
| II-173 | S | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 22. 01.3160 |
| II-174 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-MeO | m. p. 97-99°C |
| II-175 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-MeO | m. p. 98-99°C |
| II-176 | O | H | Het2 | T1 | H | m. p. 130-131°C |
| II-177 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 92-93°C |
| II-178 | S | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 71.5568 |
| II-179 | O | H | 3-F-4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 91.5947 |
| II-180 | O | H | 1-adamantyl | T1 | H | m. p. 104-105°C |
| II-181 | S | H | 5-Br-2-thienyl | T1 | H | n _D 21. 71.5486 |
| II-182 | S | Me | 4-Et-Ph | T1 | H | n _D 21. 81.6439 |
| II-183 | S | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | n _D 21. 81.5741 |
| II-184 | S | Et | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 81.5724 |
| II-185 | S | Me | 3-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 91.5008 |
| II-186 | O | H | 2-F-4-PrO-Ph | T1 | H | m. p. 62-63°C |
| II-187 | O | Pr | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 11.5637 |
| II-188 | S | Pr | 3-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 11.4974 |
| II-189 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Et | n _D 20. 01.5610 |
| II-190 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-t-Bu | n _D 20. 01.4988 |
| II-191 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-MeO | n _D 20. 01.5562 |
| II-192 | O | Me | 4-Me-Ph | T5 | 4-Me | m. p. 163-164°C |
| II-193 | S | Me | 2,4-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 11.3753 |
| II-194 | S | Me | 3-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 11.4223 |
| II-195 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Et | m. p. 65-66°C |
| II-196 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-Et | m. p. 109-110°C |
| II-197 | S | H | Het2 | T1 | H | n _D 20. 91.5535 |

| | | | | | | |
|--------|---|----|------------------------------|----|-------|-----------------------------|
| II-198 | S | Et | 4-Cl-Ph | T1 | H | oil |
| II-199 | S | Me | 3-CF ₃ -Ph | T1 | H | oil |
| II-200 | O | Me | 3-Me-Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 5766 |
| II-201 | O | Me | 3-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 5880 |
| II-202 | S | Et | 3-SO ₃ H-4-MeO-Ph | T1 | H | n _D 21. 01. 5560 |
| II-203 | S | Me | 2, 6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 11. 5595 |
| II-204 | S | H | 2, 6-F ₂ -Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 11. 5616 |
| II-205 | S | Me | 2, 5-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 4434 |
| II-206 | S | Me | 2, 4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 21. 4644 |
| II-207 | O | Me | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | m. p. 98-99°C |
| II-208 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-F | m. p. 93-94°C |
| II-209 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-F | m. p. 102-103°C |
| II-210 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-F | n _D 21. 01. 4920 |
| II-211 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-MeO | m. p. 86-87°C |
| II-212 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-MeO | m. p. 96-98°C |
| II-213 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 110-111°C |
| II-214 | O | H | C(O)OH | T1 | H | m. p. 122-123°C |
| II-215 | S | Et | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 20. 01. 5371 |
| II-216 | S | Et | 4-F-Ph | T1 | H | n _D 20. 01. 5401 |
| II-217 | S | Et | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | n _D 20. 01. 5644 |
| II-218 | S | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | H | oil |
| II-219 | S | Et | 4-Br-Ph | T1 | H | m. p. 90-92°C |
| II-220 | S | Et | 3-Br-Ph | T1 | H | n _D 20. 01. 4695 |
| II-221 | O | Et | 4-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 21. 5900 |
| II-222 | O | Et | 3-Br-Ph | T1 | H | n _D 21. 21. 5139 |
| II-223 | O | Et | 4-CF ₃ O-Ph | T1 | H | n _D 21. 21. 5296 |
| II-224 | O | Et | 3, 4-Cl ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 101-102°C |
| II-225 | O | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 74-75°C |
| II-226 | S | Me | 3-F-4-Me-Ph | T1 | H | oil |
| II-227 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-Pr | m. p. 94.5-95°C |
| II-228 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Pr | n _D 19. 01. 5688 |
| II-229 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Pr | n _D 19. 01. 5874 |
| II-230 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 6-MeO | m. p. 84.5-85°C |
| II-231 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-Me | m. p. 91-91.5°C |
| II-232 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 6-Me | m. p. 99.5-100°C |
| II-233 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 5-Me | m. p. 48.5-49.5°C |
| II-234 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 5-Me | m. p. 87.5-88.5°C |
| II-235 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 5-Me | m. p. 87-88°C |
| II-236 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Cl | m. p. 70-71°C |
| II-237 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Cl | m. p. 85.6-86°C |
| II-238 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-Cl | m. p. 143.5-145°C |
| II-239 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-F | m. p. 91.5-92.5°C |
| II-240 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-F | m. p. 67.5-68.5°C |
| II-241 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 6-F | m. p. 106-106.5°C |
| II-242 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 5-MeO | m. p. 83-84°C |
| II-243 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 5-MeO | m. p. 94.5-95.5°C |
| II-244 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-MeO | n _D 20. 21. 3871 |
| II-245 | S | Et | 3-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 01. 4720 |
| II-246 | O | Me | 4-i-Pr-Ph | T1 | H | m. p. 63-65°C |
| II-247 | O | Me | 3-CF ₃ -4-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 01. 4720 |
| II-248 | O | Et | 4-Et-Ph | T1 | H | n _D 21. 71. 5044 |
| II-249 | O | Et | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 22. 01. 5382 |
| II-250 | O | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | H | n _D 21. 01. 5333 |
| II-251 | S | Me | 3, 4-F ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41. 4630 |
| II-252 | S | Me | C(=N-OMe)Me | T1 | H | n _D 21. 41. 5022 |
| II-253 | S | Me | C(=N-OCH ₂ Ph)Me | T1 | H | n _D 21. 41. 4213 |
| II-254 | S | Me | C(=O)Me | T1 | H | n _D 21. 31. 5189 |
| II-255 | O | Me | Het3 | T1 | H | n _D 21. 01. 5186 |

| | | | | | | |
|--------|---|---------------------|------------------------------|------|---------------------|----------------------------|
| II-256 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 5-MeO | oil |
| II-257 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-Cl | m. p. 108.5-109°C |
| II-258 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 5-Cl | m. p. 81-82°C |
| II-259 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T12 | H | oil |
| II-260 | O | H | Het 4 | T1 | H | m. p. 116-117°C |
| II-261 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Ph | m. p. 114.5-115°C |
| II-262 | S | Me | 2-Me-5-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 31.5480 |
| II-263 | S | Me | 3,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | n _D 21. 41.5552 |
| II-264 | O | CO ₂ OMe | 4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 21.5909 |
| II-265 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-Ph | m. p. 115-116°C |
| II-266 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 145.9-146.5°C |
| II-267 | O | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 46-49°C |
| II-268 | O | Me | 2,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 64-66°C |
| II-269 | S | H | Het 4 | T1 | H | oil |
| II-270 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Cl | oil |
| II-271 | O | Me | 2-F-4-Br-Ph | T1 | H | m. p. 83.5-85°C |
| II-272 | O | Me | 4-Me-Ph | T2-1 | 4-Me | oil |
| II-273 | O | Et | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | n _D 22. 01.5620 |
| II-274 | O | Me | 4-Me-Ph | T9 | 3-Me | m. p. 132.5-133°C |
| II-275 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Ph | m. p. 134.3-135°C |
| II-276 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-CF ₃ | m. p. 91.6-91.8°C |
| II-277 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-PhO | m. p. 82.7-83.5°C |
| II-278 | O | Me | C(O)OH | T1 | H | n _D 21. 41.5432 |
| II-279 | O | Me | 6-Cl-3-pyridyl | T1 | H | m. p. 76-78°C |
| II-280 | O | Me | 2,5-F ₂ -4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 95-98°C |
| II-281 | O | Me | 3-Me-4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 11.5216 |
| II-282 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-CF ₃ | m. p. 86-91°C |
| II-283 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-i-Pr | n _D 21. 11.5582 |
| II-284 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 99.8-100.3°C |
| II-285 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-i-Pr | n _D 21. 61.5553 |
| II-286 | O | Me | 2-F-4-Cl-Ph | T1 | H | m. p. 64-64.5°C |
| II-287 | O | Me | 4-pyridyl | T1 | H | n _D 21. 11.4248 |
| II-288 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Br | n _D 21. 31.5943 |
| II-289 | O | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4-CF ₃ | m. p. 135.9-136.7°C |
| II-290 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-Br | n _D 21. 61.6258 |
| II-291 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-OPh | n _D 21. 41.5924 |
| II-292 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 21.5629 |
| II-293 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 3-F | m. p. 79.5-80°C |
| II-294 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 3-F | m. p. 77-78°C |
| II-295 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-F | m. p. 59-62°C |
| II-296 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Et | n _D 21. 61.5644 |
| II-297 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 88-89°C |
| II-298 | O | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | 6-Me | m. p. 92-93°C |
| II-299 | O | Me | 1-(4-Cl-Ph)-c-Pr | T1 | H | n _D 21. 11.5586 |
| II-300 | O | Me | 2-F-4-MeO-Ph | T1 | H | m. p. 119-122°C |
| II-301 | O | Me | 2-F-4-EtO-Ph | T1 | H | m. p. 70-71°C |
| II-302 | O | Me | 2-F-4-PrO-Ph | T1 | H | m. p. 56-57°C |
| II-303 | O | Me | 2-F-4-i-PrO-Ph | T1 | H | n _D 21. 11.5604 |
| II-304 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | oil |
| II-305 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | oil |
| II-306 | O | Me | 2-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 71.5538 |
| II-307 | O | Me | 3,4,5-F ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 91.5418 |
| II-308 | O | Me | 3-pyridyl | T1 | H | n _D 21. 61.4552 |
| II-309 | O | Et | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | n _D 21. 61.564 |
| II-310 | O | Me | 3-Me-4-F-Ph | T1 | H | n _D 21. 61.552 |
| II-311 | O | Me | (MeO) ₃ C | T1 | H | oil |
| II-312 | O | Me | Het 5 | T1 | H | n _D 21. 81.509 |
| II-313 | O | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-OH | oil |

| | | | | | | |
|--------|---|----|--|-----|---------------------------|---------------------|
| II-314 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-OMe | m. p. 171.5-172°C |
| II-315 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T10 | H | m. p. 155-157°C |
| II-316 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T11 | H | n_{D21} . 31.5937 |
| II-317 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-CH ₂ OMe | n_{D21} . 21.5706 |
| II-318 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-CH ₂ OMe | n_{D21} . 21.6026 |
| II-319 | 0 | Me | 3,4-Me ₂ -Ph | T1 | H | n_{D21} . 31.4968 |
| II-320 | 0 | Me | 4-I-Ph | T1 | H | m. p. 100-101°C |
| II-321 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-OH | oil |
| II-322 | 0 | Me | Het 6 | T1 | H | n_{D21} . 21.5602 |
| II-323 | 0 | Me | N≡C | T1 | H | n_{D21} . 51.5188 |
| II-324 | 0 | Me | 2-F-4-Cl-5-Me-Ph | T1 | H | n_{D21} . 51.5097 |
| II-325 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-F | oil |
| II-326 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-CF ₃ | m. p. 67-68°C |
| II-327 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-CF ₃ | m. p. 120-123°C |
| II-328 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 3,4-Me ₂ | m. p. 91.5-93°C |
| II-329 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4,5-(OMe) ₂ | m. p. 88-88.5°C |
| II-330 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 3-Me | n_{D21} . 51.5685 |
| II-331 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-CN | n_{D21} . 31.6132 |
| II-332 | 0 | Me | 2-F-4-Me-Ph | T1 | H | m. p. 85-87°C |
| II-333 | 0 | Me | 2-F-4-SMe-Ph | T1 | H | m. p. 103-105°C |
| II-334 | 0 | Me | Het 7 | T1 | H | n_{D21} . 71.6554 |
| II-335 | 0 | Me | EtOC(O) | T1 | H | n_{D21} . 71.6534 |
| II-336 | 0 | Me | Het 8 | T1 | H | n_{D21} . 71.6528 |
| II-337 | 0 | Me | 4-(2-Cl-Pr)-Ph | T1 | H | n_{D21} . 81.5788 |
| II-338 | 0 | Me | Het 9 | T1 | H | n_{D21} . 81.5412 |
| II-339 | 0 | Me | Het 10 | T1 | H | n_{D21} . 51.5318 |
| II-340 | 0 | Me | MeC(O) | T1 | H | n_{D21} . 51.5436 |
| II-341 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 3-F | oil |
| II-342 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | n_{D21} . 01.5664 |
| II-343 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-N(Me)CO ₂ Me | oil |
| II-344 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-N(Me)CO ₂ Me | oil |
| II-345 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-NHMe | oil |
| II-346 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | 6-Me | n_{D21} . 21.5773 |
| II-347 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-NHMe | oil |
| II-348 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-CN | m. p. 59-61°C |
| II-349 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-C(O)Me | m. p. 141-144°C |
| II-350 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-C(O)Me | m. p. 106-108°C |
| II-351 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-C(Me)=NOH | m. p. 148-150°C |
| II-352 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-C(Me)=NOMe | n_{D21} . 21.5796 |
| II-353 | 0 | Me | 2,3,4,5-F ₄ -Ph | T1 | H | n_{D21} . 11.4892 |
| II-354 | 0 | Me | 4-CF ₃ SO ₂ O-Ph | T1 | H | n_{D21} . 11.5186 |
| II-355 | 0 | Me | 2-Cl-PhOC(O) | T1 | H | n_{D20} . 81.5575 |
| II-356 | 0 | Me | 2-Cl-PhCH ₂ OC(O) | T1 | H | n_{D21} . 21.538 |
| II-357 | 0 | Me | 2-Cl-PhNHC(O)NH | T1 | H | m. p. 122-123°C |
| II-358 | 0 | Me | Het 11 | T1 | H | n_{D21} . 21.4764 |
| II-359 | 0 | Me | Het 12 | T1 | H | m. p. 179-182°C |
| II-360 | 0 | Me | Het 13 | T1 | H | m. p. 189-192°C |
| II-361 | 0 | Me | 2-F-4,5-Me ₂ -Ph | T1 | H | n_{D21} . 41.5132 |
| II-362 | 0 | H | PhCH ₂ | T1 | H | n_{D21} . 41.5038 |
| II-363 | 0 | Me | 2-Cl-PhOC(O)NH | T1 | H | n_{D21} . 51.5737 |
| II-364 | 0 | Me | Het 14 | T1 | H | n_{D21} . 21.4838 |
| II-365 | 0 | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | m. p. 120-122°C |
| II-366 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-OCH ₂ Ph | m. p. 90-91.5°C |
| II-367 | 0 | Me | MeC(O) | T1 | 4-Br | n_{D21} . 21.6006 |
| II-368 | 0 | Me | MeC(=NOCH ₂ Ph) | T1 | H | n_{D21} . 31.5562 |
| II-369 | 0 | Me | MeC(=NOMe) | T1 | H | n_{D21} . 31.5088 |
| II-370 | 0 | Me | Het 15 | T1 | H | m. p. 113-114°C |
| II-371 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T5 | H | m. p. 151-152°C |

| | | | | | | |
|--------|---|---------------------|--|----|------------------------------------|-----------------------------|
| II-372 | 0 | Me | 4-CHF ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 114-115°C |
| II-373 | 0 | Me | Het16 | T1 | H | m. p. 131-134°C |
| II-374 | 0 | Me | HOC(O) | T1 | 4-Me | n _D 21. 21. 6006 |
| II-375 | 0 | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | 6-Me | n _D 21. 21. 5938 |
| II-376 | 0 | H | t-Bu | T1 | H | n _D 21. 51. 5289 |
| II-377 | 0 | H | t-Bu | T1 | 4-Br | n _D 22. 71. 5527 |
| II-378 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 117-118°C |
| II-379 | 0 | Me | Het17 | T1 | H | m. p. 110-111°C |
| II-380 | 0 | Me | CF ₃ CH ₂ OC(O)NH | T1 | H | m. p. 86-87°C |
| II-381 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-OSO ₂ Me | n _D 21. 31. 5247 |
| II-382 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | 4-Et | m. p. 84.5-85°C |
| II-383 | 0 | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Et | oil |
| II-384 | 0 | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | 4-Et | m. p. 109-110°C |
| II-385 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-NMe ₂ | m. p. 77.8-78.5°C |
| II-386 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-NMe ₂ | m. p. 95-3-95.8°C |
| II-387 | 0 | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 41. 4994 |
| II-388 | 0 | Me | 4-Cl-Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | n _D 21. 31. 6076 |
| II-389 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | m. p. 104-106°C |
| II-390 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | n _D 21. 31. 5618 |
| II-391 | 0 | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4,6-Me ₂ | n _D 21. 41. 5667 |
| II-392 | 0 | H | MeC(=NOH) | T1 | H | n _D 21. 41. 5888 |
| II-393 | 0 | Me | t-BuNHC(O)NH | T1 | H | n _D 21. 21. 5480 |
| II-394 | 0 | Me | s-BuNHC(O)NH | T1 | H | n _D 21. 21. 5627 |
| II-395 | 0 | Me | CF ₃ CH ₂ NHC(O)NH | T1 | H | m. p. 99-101°C |
| II-396 | 0 | Me | Het18 | T1 | H | m. p. 156-157°C |
| II-397 | 0 | Cl | 4-Me-Ph | T1 | H | oil |
| II-398 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | 4-Et | n _D 21. 31. 5690 |
| II-399 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T1 | 4-Me | n _D 21. 41. 5732 |
| II-400 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 6-OSO ₂ CF ₃ | n _D 21. 71. 3945 |
| II-401 | 0 | H | Hex | T1 | H | n _D 21. 41. 5132 |
| II-402 | 0 | Pen | Me | T1 | H | n _D 21. 51. 4926 |
| II-403 | 0 | Me | MeC(=NOH) | T1 | H | oil |
| II-404 | 0 | MeS | 4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 31. 5336 |
| II-405 | 0 | Me | Het19 | T1 | H | m. p. 140-143°C |
| II-406 | 0 | Me | Het20 | T1 | H | m. p. 156-157°C |
| II-407 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-SMe | m. p. 57.5-58.5°C |
| II-408 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-SMe | m. p. 93.5-94°C |
| II-409 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-S(O)Me | m. p. 106-107°C |
| II-410 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T1 | 4-OC(O)Me | n _D 21. 31. 3994 |
| II-411 | 0 | Pr | Me | T1 | H | n _D 21. 71. 5692 |
| II-412 | 0 | H | Bu | T1 | H | n _D 21. 71. 5097 |
| II-413 | 0 | Me | Het21 | T1 | H | m. p. 178-180°C |
| II-414 | 0 | Me | Het22 | T1 | H | m. p. 130-131°C |
| II-415 | 0 | MeS(O) | 4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 20. 51. 5138 |
| II-416 | 0 | MeSO ₂ | 4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 20. 61. 4335 |
| II-417 | 0 | H | t-BuCH ₂ | T1 | H | n _D 21. 01. 5301 |
| II-418 | 0 | Me | 2-Cl-3-Pyridyl | T1 | H | m. p. 94-95°C |
| II-419 | 0 | Me | 2-Me-4-thiazolyl | T1 | H | m. p. 105-106°C |
| II-420 | 0 | H | t-BuCH ₂ | T1 | 4-Br | oil |
| II-421 | 0 | Me | 4-Br-2-thienyl | T1 | H | m. p. 114-115°C |
| II-422 | 0 | PhCH ₂ S | 4-Cl-Ph | T1 | H | n _D 21. 21. 5486 |
| II-423 | 0 | Me | Het24 | T1 | H | m. p. 125-126°C |
| II-424 | 0 | Cl | 3,4-F ₂ -Ph | T1 | H | m. p. 86-87°C |
| II-425 | 0 | Cl | 4-t-Bu-Ph | T1 | H | n _D 20. 71. 5306 |
| II-426 | 0 | Me | Het25 | T1 | H | n _D 20. 31. 5548 |
| II-427 | 0 | Me | Het26 | T1 | H | oil |
| II-428 | 0 | Me | Het27 | T1 | H | m. p. 114-115°C |
| II-429 | 0 | Me | 2-quinoquazalyl | T1 | H | m. p. 117-118°C |

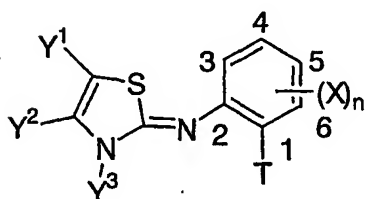
| | | | | | | |
|--------|---|-----------------------|---|-----|-----------|----------------------------|
| II-430 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5290 |
| II-431 | 0 | Me | 4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph | T1 | H | m. p. 139-140°C |
| II-432 | 0 | Me | Het28 | T1 | H | m. p. 39-40°C |
| II-433 | 0 | Me | Het29 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5752 |
| II-434 | 0 | H | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5809 |
| II-435 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₁ . 41.6510 |
| II-436 | 0 | Me | Het30 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5678 |
| II-437 | 0 | Me | Het31 | T1 | H | m. p. 79-80°C |
| II-438 | 0 | Me | Het32 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5327 |
| II-439 | 0 | Me | Het33 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5431 |
| II-440 | 0 | Me | Het34 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5352 |
| II-441 | 0 | Me | 2-quinolyl | T1 | H | m. p. 99-100°C |
| II-442 | 0 | Me | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | 6-Me | m. p. 80-83°C |
| II-443 | 0 | Me | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | H | oil |
| II-444 | 0 | H | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | 6-Me | m. p. 99-93°C |
| II-445 | 0 | Me | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | 4-Me | m. p. 107-108°C |
| II-446 | 0 | Et | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | 6-Me | oil |
| II-447 | 0 | Et | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T1 | H | oil |
| II-448 | 0 | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 103-104°C |
| II-449 | 0 | H | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me | m. p. 94-95°C |
| II-450 | 0 | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 119-120°C |
| II-451 | 0 | Me | 5-Cl-2-thienyl | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5372 |
| II-452 | 0 | Me | 5-Me-2-thienyl | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5726 |
| II-453 | 0 | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me-6-Cl | m. p. 158-162°C |
| II-454 | 0 | H | 4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Me-5-Cl | nD ₂₁ . 41.6492 |
| II-455 | 0 | H | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-Me-6-Cl | nD ₂₀ . 41.5082 |
| II-456 | 0 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 100-101°C |
| II-457 | 0 | Me | 5-I-2-thienyl | T1 | H | nD ₂₀ . 41.4710 |
| II-458 | 0 | Me | 5-I-2-thienyl | T7 | H | nD ₂₀ . 41.4890 |
| II-459 | 0 | Me | Het35 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5282 |
| II-460 | 0 | Me | 5-CF ₃ -2-thienyl | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5145 |
| II-461 | 0 | Me | 5-CF ₃ -2-thienyl | T7 | H | nD ₂₀ . 41.4716 |
| II-462 | 0 | Me | Het35 | T7 | H | nD ₂₀ . 41.5437 |
| II-463 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | H | nD ₂₀ . 41.5632 |
| II-464 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | Me | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5774 |
| II-465 | 0 | 3-Cl-Ph | Me | T1 | H | nD ₂₀ . 41.6143 |
| II-466 | 0 | 4-Me-Ph | Me | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5962 |
| II-467 | 0 | Me | Het36 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.4752 |
| II-468 | 0 | 2-Cl-Ph | Me | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5992 |
| II-469 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T13 | H | m. p. 104-106°C |
| II-470 | 0 | Me | 3-thienyl | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5042 |
| II-471 | 0 | Me | 2-F-5-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5636 |
| II-472 | 0 | Me | 2-F-3-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5296 |
| II-473 | 0 | H | 2,4,6-F ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5282 |
| II-474 | 0 | Me | Het37 | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5154 |
| II-475 | 0 | Me | 3-F-5-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5076 |
| II-476 | 0 | Me | 2,4,6-F ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.4725 |
| II-477 | 0 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 71-73°C |
| II-478 | 0 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T6 | 4-Me | m. p. 113-114°C |
| II-479 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T6 | 4-Me | m. p. 174-175°C |
| II-480 | 0 | Me | 3-F-5-CF ₃ -Ph | T6 | H | nD ₂₀ . 41.5621 |
| II-481 | 0 | Me | Het37 | T6 | H | nD ₂₀ . 41.5621 |
| II-482 | 0 | H | 4-Me-Ph | T6 | H | m. p. 136-137°C |
| II-483 | 0 | Me | 2,4,6-F ₃ -Ph | T6 | H | m. p. 61-62°C |
| II-484 | 0 | H | 2-Cl-4-CF ₃ -Ph | T1 | H | nD ₂₀ . 41.5582 |
| II-485 | 0 | Me | Het37 | T1 | 6-Me | nD ₂₀ . 41.5243 |
| II-486 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T14 | H | m. p. 115-116°C |
| II-487 | 0 | H | 2-Cl-4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-Me | m. p. 109-110°C |

| | | | | | | |
|--------|---|-----|---|-----|---------------------|---------------------------|
| II-488 | O | Me | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T6 | H | oil |
| II-489 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | H | m.p. 113-114°C |
| II-490 | O | Me | Het38 | T1 | H | n _D 20. 1.5483 |
| II-491 | O | H | 4-CF ₃ -Ph | T6 | H | m.p. 175-176°C |
| II-492 | O | H | 2-Cl-4-CF ₃ -Ph | T6 | H | n _D 21. 1.4650 |
| II-493 | O | Me | 2-thienyl | T1 | 6-Me | n _D 20. 1.5409 |
| II-494 | O | Me | 5-CF ₃ -2-thienyl | T1 | 6-Me | n _D 20. 1.4844 |
| II-495 | O | Me | 2-thienyl | T1 | H | n _D 21. 1.5172 |
| II-496 | O | Me | 5-CF ₃ -3-thienyl | T1 | H | n _D 21. 1.4925 |
| II-497 | O | Me | 5-CF ₃ -3-thienyl | T1 | 6-Me | n _D 20. 1.4612 |
| II-498 | O | Me | 5-CF ₃ -3-thienyl | T6 | H | m.p. 42-43°C |
| II-499 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-Me | m.p. 134-135°C |
| II-500 | O | N≡C | Ph | T1 | H | m.p. 103-105°C |
| II-501 | O | Me | Het39 | T1 | H | m.p. 110-111°C |
| II-502 | S | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 167-169°C |
| II-503 | S | H | 2,6-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 136-138°C |
| II-504 | S | Me | Ph | T6 | H | m.p. 138-140°C |
| II-505 | S | H | 2,3-Me ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 131-133°C |
| II-506 | S | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 133-135°C |
| II-507 | S | H | 3,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 155-156°C |
| II-508 | O | Me | 4-Me-Ph | T6 | 6-F | m.p. 153-155°C |
| II-509 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-OMe | m.p. 103-105°C |
| II-510 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-F | m.p. 99-104°C |
| II-511 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Et | m.p. 110-110°C |
| II-512 | O | Me | 2,6-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 123-124°C |
| II-513 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T15 | H | m.p. 128-129°C |
| II-514 | O | Me | Het37 | T6 | 6-Me | m.p. 84-85°C |
| II-515 | O | H | 2-Cl-4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-Me | m.p. 117-118°C |
| II-516 | O | Me | 5-CF ₃ -2-thienyl | T1 | H | m.p. 147-148°C |
| II-517 | O | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T6 | 6-Me | m.p. 126-128°C |
| II-518 | O | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 166-169°C |
| II-519 | O | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-Me | m.p. 120-122°C |
| II-520 | O | Me | Het40 | T1 | H | oil |
| II-521 | O | Me | 5-CF ₃ -2-thienyl | T6 | 6-Me | m.p. 135-136°C |
| II-522 | O | Me | 3,5-F ₂ -4-Me-Ph | T1 | H | n _D 20. 1.4905 |
| II-523 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T13 | H | m.p. 112-115°C |
| II-524 | O | Et | 4-CF ₃ -Ph | T6 | H | m.p. 122-124°C |
| II-525 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 3-F | m.p. 106-108°C |
| II-526 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 149-150°C |
| II-527 | O | Me | Het33 | T6 | H | m.p. 161-163°C |
| II-528 | O | Me | 4-CF ₃ -2-thienyl | T1 | H | n _D 21. 1.4635 |
| II-529 | O | Me | 3-CF ₃ -2-thienyl | T1 | H | n _D 21. 1.4956 |
| II-530 | O | Me | 4-1-2-thienyl | T1 | H | m.p. 135-136°C |
| II-531 | O | Me | 3,5-F ₂ -4-Me-Ph | T1 | 6-Me | m.p. 70-71°C |
| II-532 | O | Me | Het41 | T1 | H | n _D 21. 1.5796 |
| II-533 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-Me | m.p. 125-126°C |
| II-534 | O | Me | 4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph | T16 | H | m.p. 118-118.5°C |
| II-535 | O | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 71-73°C |
| II-536 | O | H | Ph | T6 | H | m.p. 161-163°C |
| II-537 | O | H | 2-Cl-Ph | T6 | H | m.p. 107-108°C |
| II-538 | O | H | 3-Cl-Ph | T6 | H | m.p. 163-165°C |
| II-539 | O | H | 2-Me-Ph | T6 | H | m.p. 91-93°C |
| II-540 | O | H | 3-Me-Ph | T6 | H | m.p. 142-144°C |
| II-541 | O | H | 2,6-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 127-129°C |
| II-542 | O | H | 4-Br-Ph | T6 | H | m.p. 142-144°C |
| II-543 | O | H | 4-F-Ph | T6 | H | m.p. 166-167°C |
| II-544 | O | H | 3,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 182-183°C |
| II-545 | O | H | 4-NO ₂ -Ph | T6 | H | m.p. 179-180°C |

| | | | | | | |
|--------|---|-----|------------------------------|------|------------------------|-----------------------------|
| II-546 | 0 | H | 4-(N≡C-)-Ph | T6 | H | m. p. 180-182°C |
| II-547 | 0 | H | 4-PhO-Ph | T6 | H | m. p. 130-131°C |
| II-548 | 0 | H | 2,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 120-122°C |
| II-549 | 0 | H | 4-i-Pr-Ph | T6 | H | m. p. 121-123°C |
| II-550 | 0 | Me | 3-CF ₃ -2-thienyl | T1 | 6-Me | n _D 20. 51. 4938 |
| II-551 | 0 | Me | 4-CF ₃ -2-thienyl | T1 | 6-Me | n _D 20. 51. 4754 |
| II-552 | 0 | Me | 4-I-2-thienyl | T1 | 6-Me | m. p. 123-124°C |
| II-553 | 0 | Me | 3,5-F ₂ -4-Me-Ph | T6 | H | n _D 20. 51. 5327 |
| II-554 | 0 | MeS | 4-Cl-Ph | T6 | H | m. p. 137-138°C |
| II-555 | 0 | Me | 3,5-F ₂ -4-Me-Ph | T6 | 6-Me | m. p. 66-67°C |
| II-556 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 6-NO ₂ | n _D 20. 51. 5038 |
| II-557 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T1 | 4-NO ₂ | m. p. 97-98°C |
| II-558 | 0 | Me | 4-Cl-Ph | T13 | H | m. p. 133-135°C |
| II-559 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T17 | H | oil |
| II-560 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T18 | H | m. p. 155.5-156°C |
| II-561 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T19 | H | m. p. 101-102°C |
| II-562 | 0 | Et | Ph | T6 | H | m. p. 156-158°C |
| II-563 | 0 | Me | 4-F-Ph | T6 | H | m. p. 106-108°C |
| II-564 | 0 | Me | 2-Cl-Ph | T6 | H | m. p. 95-97°C |
| II-565 | 0 | Me | 3,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 127-129°C |
| II-566 | 0 | Et | 4-Cl-Ph | T6 | H | m. p. 102-104°C |
| II-567 | 0 | Me | 4-Cl-Ph | T6 | H | m. p. 98-100°C |
| II-568 | 0 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T6 | 6-Me | m. p. 175-177°C |
| II-569 | 0 | H | 2-Me-4-thiazolyl | T1 | H | m. p. 119-121°C |
| II-570 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T20 | H | m. p. 221-223°C |
| II-571 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T21 | H | m. p. 173-175°C |
| II-572 | 0 | Me | 2-F-4-CF ₃ -Ph | T13 | H | m. p. 73-76°C |
| II-573 | 0 | Me | 4-Br-Ph | T6 | H | m. p. 128-130°C |
| II-574 | 0 | Me | 2,4-F ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 85-87°C |
| II-575 | 0 | Me | 4-Et-Ph | T6 | H | m. p. 85-86°C |
| II-576 | 0 | Me | 2,4-Cl ₂ -Ph | T6 | H | m. p. 101-103°C |
| II-577 | 0 | Me | 4-F-3-CF ₃ -Ph | T6 | H | m. p. 125-127°C |
| II-578 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 5-Me | m. p. 138-139°C |
| II-579 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-F | m. p. 105-109°C |
| II-580 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T6 | 5-OMe | m. p. 125-127°C |
| II-581 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T6 | 5-Cl | m. p. 183-185°C |
| II-582 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Ph | m. p. 192-194°C |
| II-583 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T6 | H | m. p. 145-147°C |
| II-584 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T6 | H | m. p. 134-135°C |
| II-585 | 0 | Me | 3-Cl-Ph | T6 | H | n _D 21. 21. 5709 |
| II-586 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T6 | H | n _D 21. 11. 5313 |
| II-587 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T6 | 6-Me | m. p. 153-155°C |
| II-588 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4,5-(OMe) ₂ | m. p. 161-162°C |
| II-589 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-(NMe ₂) | m. p. 161-162°C |
| II-590 | 0 | Me | 4-t-Bu-Ph | T6 | 4-Me | m. p. 133-134°C |
| II-591 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T6 | 4-Et | m. p. 83-85°C |
| II-592 | 0 | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T6 | 4-Me | m. p. 85-86°C |
| II-593 | 0 | H | t-BuCH ₂ | T6 | H | m. p. 86-87°C |
| II-594 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T2-1 | H | oil |
| II-595 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T22 | H | oil |
| II-596 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T29 | H | oil |
| II-597 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T28 | 6-Me | oil |
| II-598 | 0 | H | 2,4-Cl ₂ -Ph | T13 | H | m. p. 92-95°C |
| II-599 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T13 | 6-Me | oil |
| II-600 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T30 | H | oil |
| II-601 | 0 | Me | 4-CF ₃ -Ph | T31 | H | oil |
| II-602 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T32 | H | m. p. 131-132°C |
| II-603 | 0 | Me | 4-Me-Ph | T33 | H | m. p. 92-93°C |

| | | | | | | |
|--------|---|----|---------------------------|-----|---------------------|-------------------|
| II-604 | S | Me | 4-Me-Ph | T28 | H | oil |
| II-605 | S | Me | 4-Me-Ph | T13 | H | m.p. 130-133°C |
| II-606 | O | Me | 3-Me-Ph | T13 | H | n_D^{25} 1.5467 |
| II-607 | O | Me | 4-Me-Ph | T34 | H | oil |
| II-608 | O | Me | 4-Cl-Ph | T28 | H | n_D^{25} 1.6094 |
| II-609 | O | Me | Het 35 | T6 | H | m.p. 118-119°C |
| II-610 | O | Me | 4-Me-Ph | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 149-151°C |
| II-611 | O | Me | 3-CF ₃ O-Ph | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 123-124°C |
| II-612 | O | Me | 3-F-4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Et | m.p. 92-93°C |
| II-613 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-OMe | m.p. 101-102°C |
| II-614 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-Cl | m.p. 128-130°C |
| II-615 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-t-Bu | m.p. 111-112°C |
| II-616 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 6-OMe | m.p. 127-128°C |
| II-617 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Et | m.p. 85-86°C |
| II-618 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Me | m.p. 89-90°C |
| II-619 | O | Me | 4-CF ₃ -Ph | T6 | 4-Pr | m.p. 90-91°C |

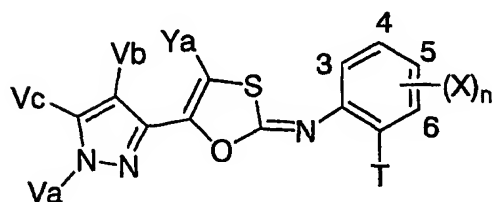
〔第 10 表〕



| No. | Y ¹ | Y ² | Y ³ | T | X | 物性(m.p.等)備考 |
|--------|----------------|----------------|-------------------|--|---|-------------------|
| III-1 | H | Ph | Et | T1 | H | n_D^{25} 1.5160 |
| III-2 | H | Ph | Et | T2-1 | H | n_D^{25} 1.5378 |
| III-3 | H | Ph | Et | T2-2 | H | n_D^{25} 1.4961 |
| III-4 | H | Ph | Ph | T1 | H | n_D^{25} 1.5702 |
| III-5 | H | Ph | Ph | T2-1 | H | m.p. 73-74°C |
| III-6 | H | Ph | Ph | T2-1 | H | n_D^{25} 1.5112 |
| III-7 | H | Ph | C(=O)OEt | T1 | H | m.p. 122-123°C |
| III-8 | H | Ph | PhCH ₂ | T1 | H | m.p. 130-131°C |
| III-9 | H | Ph | PhCH ₂ | T2-1 | H | m.p. 134-136°C |
| III-10 | H | Ph | PhCH ₂ | T2-2 | H | m.p. 145-147°C |
| III-11 | H | Ph | Me ₂ N | T1 | H | m.p. 88-89°C |
| III-12 | H | Ph | Me ₂ N | T2-1 | H | m.p. 113-114°C |
| III-13 | H | Ph | Me ₂ N | T2-2 | H | m.p. 133-134°C |
| III-14 | H | Ph | Me | CH ₂ COOPr | H | n_D^{25} 1.5711 |
| III-15 | H | Ph | Me | CH ₂ COOBu | H | n_D^{25} 1.5545 |
| III-16 | H | Ph | Me | CH ₂ COOPen | H | n_D^{25} 1.5762 |
| III-17 | H | Ph | Me | CH ₂ COOCH ₂ CH ₂ OMe | H | n_D^{25} 1.5792 |
| III-18 | H | Ph | Me | CH ₂ COOCH ₂ Ph | H | m.p. 139-141°C |
| III-19 | H | Ph | Me | CH ₂ CONH-i-Pr | H | m.p. 119-121°C |
| III-20 | H | Ph | Me | T26 | H | m.p. 119-121°C |
| III-21 | H | Ph | Me | T27 | H | m.p. 111-112°C |
| III-22 | H | H | PhCH ₂ | T1 | H | n_D^{25} 1.6236 |
| III-23 | H | Me | PhCH ₂ | T1 | H | n_D^{25} 1.6136 |

| | | | | | | |
|--------|---|---------|------------------|---------------------------|---|----------------------|
| III-24 | H | H | Ph | T1 | H | m. p. 86-88°C |
| III-25 | H | Ph | Pr | T1 | H | m. p. 91-92°C |
| III-26 | H | Ph | i-Pr | T1 | H | m. p. 72-73°C |
| III-27 | H | Me | PhMeN | T1 | H | n_D^{21} 21.6190 |
| III-28 | H | Ph | H ₂ N | T1 | H | 200°C (decomp) HBr 塩 |
| III-29 | H | Ph | Me | T9 | H | m. p. 112-113°C |
| III-30 | H | 2-Cl-Ph | Me | T9 | H | 油状物 |
| III-31 | H | Ph | Me | -O-T1 | H | m. p. 119-121°C |
| III-32 | H | Ph | Me | -O-T2-1 | H | 油状物 |
| III-33 | H | Ph | Me | T13 | H | m. p. 161-163°C |
| III-34 | H | Ph | Me | -NH-T1 | H | m. p. 119-123°C |
| III-35 | H | Ph | Me | -N(Me)-CO ₂ Me | H | n_D^{21} 21.6232 |
| III-36 | H | Ph | Me | -N(Me)-T1 | H | m. p. 120-122°C |
| III-37 | H | Ph | Me | -S-T1 | H | m. p. 110-112°C |
| III-38 | H | Ph | Me | -S-T6 | H | m. p. 168-170°C |
| III-39 | H | Ph | Me | T10 | H | n_D^{21} 21.5285 |
| III-40 | H | Ph | Me | -O-Ph | H | m. p. 131-132°C |
| III-41 | H | Ph | Me | T11 | H | m. p. 134-136°C |
| III-42 | H | Ph | Me | T23 | H | m. p. 109-111°C |
| III-43 | H | Ph | Me | T24 | H | m. p. 88-90°C |
| III-44 | H | Ph | Me | T25 | H | m. p. 171-172°C |

〔第 1 1 表〕

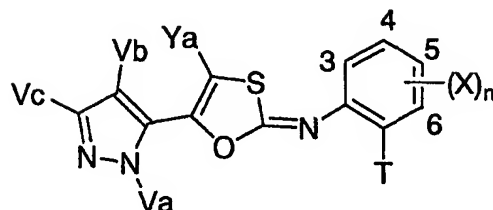


| No. | Q | Va | Vb | Vc | Ya | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|-------|---|------------------------------------|----|-----------------|----|----|-------|-----------------------|
| IV-1 | 0 | Me | Br | Me | Me | T1 | H | n_D^{21} 21.4606 |
| IV-2 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{21} 21.4310 |
| IV-3 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | n_D^{21} 21.5206 |
| IV-4 | 0 | Me | Br | t-Bu | Me | T1 | H | n_D^{20} 20.41.3572 |
| IV-5 | 0 | Me | H | t-Bu | Me | T1 | H | n_D^{20} 20.51.4941 |
| IV-6 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{20} 20.21.4269 |
| IV-7 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | n_D^{20} 20.51.5496 |
| IV-8 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | m. p. 64-65°C |
| IV-9 | 0 | H | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 95-96°C |
| IV-10 | 0 | H | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | m. p. 112.5-113.5°C |
| IV-11 | 0 | i-Pr | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{24} 24.01.4602 |
| IV-12 | 0 | Pr | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{22} 22.81.4803 |
| IV-13 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-MeO | n_D^{20} 20.01.5468 |
| IV-14 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | n_D^{19} 19.91.5440 |
| IV-15 | 0 | MeOCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{19} 19.51.4712 |
| IV-16 | 0 | N≡CCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{22} 22.11.4558 |
| IV-17 | 0 | CH ₂ =CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n_D^{22} 22.11.4995 |
| IV-18 | 0 | MeSO ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | oil |

| | | | | | | | | |
|-------|---|--|----|-------------------|----|-----|------|----------------------------|
| IV-19 | 0 | Me | H | Ph | Me | T1 | H | m. p. 119-119.5°C |
| IV-20 | 0 | Me | Br | Ph | Me | T1 | H | m. p. 135.5-136°C |
| IV-21 | 0 | Me | H | Me | Me | T1 | H | m. p. 116-118°C |
| IV-22 | 0 | PhCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 81.4760 |
| IV-23 | 0 | Me | H | Cl | Me | T1 | H | n _D 20. 81.4696 |
| IV-24 | 0 | Me | Br | Cl | Me | T1 | H | m. p. 90-91°C |
| IV-25 | 0 | Me | H | Cl | Me | T1 | 4-Me | n _D 20. 81.4671 |
| IV-26 | 0 | Me | Br | Cl | Me | T1 | 4-Me | n _D 20. 41.5103 |
| IV-27 | 0 | Pr | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | n _D 21. 11.4620 |
| IV-28 | 0 | Me | H | OCHF ₂ | Me | T1 | H | n _D 20. 71.5632 |
| IV-29 | 0 | Me | H | OCHF ₂ | Me | T1 | 6-Me | n _D 20. 71.5482 |
| IV-30 | 0 | N≡CCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 19. 81.5619 |
| IV-31 | 0 | Me ₃ SiCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 41.4707 |
| IV-32 | 0 | F ₂ HC | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 21. 11.5150 |
| IV-33 | 0 | MeSCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 31.4858 |
| IV-34 | 0 | Cl ₂ C=CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 41.5234 |
| IV-35 | 0 | Me ₂ SO ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 51.5460 |
| IV-36 | 0 | i-Bu | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 52.5-54°C |
| IV-37 | 0 | Bu | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 41.5033 |
| IV-38 | 0 | MeOC(O)CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 31.5216 |
| IV-39 | 0 | Ph | H | t-Bu | Me | T1 | H | n _D 20. 11.5206 |
| IV-40 | S | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 91.5337 |
| IV-41 | 0 | c-Pr-CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 18. 51.5913 |
| IV-42 | 0 | Me | H | Et | Me | T1 | H | m. p. 74-75°C |
| IV-43 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | m. p. 101-103°C |
| IV-44 | 0 | Me | H | i-Pr | Me | T1 | H | m. p. 73-75°C |
| IV-45 | 0 | Me | H | Bu | Me | T1 | H | m. p. 81-82°C |
| IV-46 | 0 | Me | Pr | Me | Me | T1 | H | m. p. 76-78°C |
| IV-47 | 0 | Me | H | Pr | Me | T1 | H | m. p. 99-101°C |
| IV-48 | 0 | Pr | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | n _D 18. 51.5492 |
| IV-49 | 0 | CF ₃ CH ₂ CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 19. 81.5246 |
| IV-50 | 0 | Me | H | CF ₃ | Cl | T1 | 6-Me | n _D 11. 01.4919 |
| IV-51 | 0 | FCH ₂ CH ₂ CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 31.4965 |
| IV-52 | 0 | Cl ₂ CCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 112-113°C |
| IV-53 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 71.4724 |
| IV-54 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | n _D 20. 51.5378 |
| IV-55 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T6 | 6-Me | m. p. 152-154°C |
| IV-56 | 0 | F ₂ HC | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | n _D 18. 21.5436 |
| IV-57 | 0 | F ₂ HC | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | n _D 18. 41.5199 |
| IV-58 | 0 | H ₂ C=CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | n _D 18. 81.5348 |
| IV-59 | 0 | H | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Me | m. p. 105-106.5°C |
| IV-60 | 0 | F ₂ HCCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 11.4460 |
| IV-61 | 0 | Me | H | CF ₃ | Et | T1 | H | n _D 20. 81.4782 |
| IV-62 | 0 | Me | H | CF ₃ | Et | T1 | 6-Me | n _D 20. 91.5300 |
| IV-63 | 0 | Me | H | CF ₃ | Et | T6 | H | m. p. 160-161°C |
| IV-64 | 0 | Me | H | CF ₃ | Et | T6 | 6-Me | m. p. 136-137°C |
| IV-65 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T6 | H | m. p. 182-183°C |
| IV-66 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T5 | 6-Me | m. p. 184.5-185.5°C |
| IV-67 | 0 | Me | H | CF ₃ | H | T6 | H | m. p. 173-174°C |
| IV-68 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-F | oil |
| IV-69 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T6 | 6-F | m. p. 134-134.5°C |
| IV-70 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 6-Cl | oil |
| IV-71 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T6 | 6-Cl | m. p. 143-145°C |
| IV-72 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T14 | 6-Me | oil |
| IV-73 | 0 | 2-pyridyl | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 150-152°C |
| IV-74 | 0 | Me | H | CF ₃ | H | T6 | 6-Me | m. p. 72-73°C |
| IV-75 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T6 | H | m. p. 130-133°C |
| IV-76 | 0 | F ₂ HC | H | CF ₃ | H | T6 | H | m. p. 109-110°C |

| | | | | | | | | |
|-------|---|----|---|-----------------|----|------|------|---------------------------|
| IV-77 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T6 | 4-Me | m. p. 114-115°C |
| IV-78 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T6 | 4-Me | m. p. 149.5-150°C |
| IV-79 | 0 | Pr | H | CF ₃ | Me | T6 | H | m. p. 73-74°C |
| IV-80 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T15 | H | m. p. 134-135°C |
| IV-81 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T18 | 6-Me | m. p. 140-144°C |
| IV-82 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T16 | H | m. p. 151-153°C |
| IV-83 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T13 | H | oil |
| IV-84 | 0 | Me | H | t-Bu | Me | T1 | 6-Me | m. p. 103-105°C |
| IV-85 | 0 | Me | H | t-Bu | Me | T6 | 6-Me | m. p. 132-134°C |
| IV-86 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T18 | H | n _D 20. 1.5457 |
| IV-87 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T9 | H | m. p. 62-64°C |
| IV-88 | 0 | Me | H | Me | Me | T6 | H | m. p. 170-173°C |
| IV-89 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T28 | H | m. p. 100-103°C |
| IV-90 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T13 | 4-Me | oil |
| IV-91 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T2-1 | H | m. p. 140-142°C |
| IV-92 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T22 | H | oil |
| IV-93 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T13 | 6-Me | m. p. 55-58°C |
| IV-94 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T28 | 6-Me | oil |
| IV-95 | 0 | Me | H | CF ₃ | Et | T13 | H | n _D 21. 1.4830 |
| IV-96 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T32 | H | m. p. 98-99°C |
| IV-97 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T33 | H | m. p. 129-130°C |
| IV-98 | 0 | Me | H | Cl | Me | T6 | H | m. p. 168-170°C |
| IV-99 | 0 | Et | H | CF ₃ | Me | T6 | 6-Me | m. p. 124-125°C |

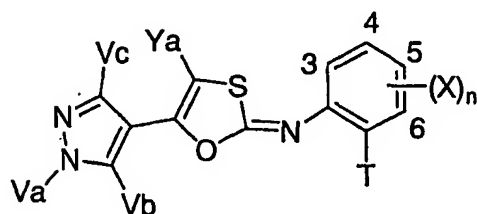
〔第 1 2 表〕



| No. | Q | Va | Vb | Vc | Ya | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|------|---|------------------------------------|----|-----------------|----|----|-------|---------------------------|
| V-1 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 21. 1.4868 |
| V-2 | 0 | Me | H | Cl | Me | T1 | H | n _D 21. 1.5118 |
| V-3 | 0 | Me | Br | Cl | Me | T1 | H | oil |
| V-4 | 0 | Me | Br | Me | Me | T1 | H | n _D 21. 1.4222 |
| V-5 | 0 | Me | H | Cl | H | T1 | H | n _D 20. 1.5933 |
| V-6 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-Me | n _D 20. 1.5484 |
| V-7 | 0 | i-Pr | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 1.4179 |
| V-8 | 0 | Me | Me | Me | H | T1 | H | n _D 22. 1.5032 |
| V-9 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | 4-MeO | m. p. 117-119°C |
| V-10 | 0 | N≡CCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 1.4950 |
| V-11 | 0 | CH ₂ =CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 1.4836 |
| V-12 | 0 | MeSO ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 125-127°C |
| V-13 | 0 | PhCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 1.4799 |
| V-14 | 0 | t-Bu | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 1.4842 |
| V-15 | 0 | CH≡CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 19. 1.5000 |
| V-16 | 0 | Me ₃ SiCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 1.5223 |

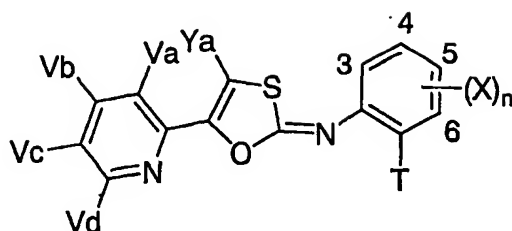
| | | | | | | | | |
|------|---|--|---|-----------------|----|----|---|----------------------------|
| V-17 | 0 | F ₂ HC | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 21. 11.4728 |
| V-18 | 0 | MeSCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 21.5231 |
| V-19 | 0 | Cl ₂ C=CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 81.5476 |
| V-20 | 0 | i-Bu | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 31.4566 |
| V-21 | 0 | MeOC(O)CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 21.5170 |
| V-22 | 0 | c-Pr-CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 62-63°C |
| V-23 | 0 | F ₃ CCH ₂ CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 19. 61.5173 |
| V-24 | 0 | FCH ₂ CH ₂ CH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 20. 11.5240 |
| V-25 | 0 | H ₂ C=CHCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 18. 71.5430 |
| V-26 | 0 | F ₂ HCCH ₂ | H | CF ₃ | Me | T1 | H | n _D 22. 11.4966 |

〔第 13 表〕



| No. | Q | Va | Vb | Vc | Ya | T | X | 物性(m. p. 等) |
|-------|---|---------------------------------|----|-----------------|----|-----|------|----------------------------|
| VI-1 | 0 | Me | Cl | Cl | Me | T1 | H | m. p. 84-87°C |
| VI-2 | 0 | Me | H | CF ₃ | Me | T1 | H | m. p. 78.5-80°C |
| VI-3 | 0 | Me | H | Cl | H | T1 | H | n _D 22. 81.5773 |
| VI-4 | 0 | Me | H | H | Me | T1 | H | n _D 19. 61.5240 |
| VI-5 | 0 | 2-pyridyl | H | H | Me | T1 | H | n _D 20. 51.5362 |
| VI-6 | 0 | Pr | H | H | Me | T1 | H | n _D 22. 21.5236 |
| VI-7 | 0 | Pr | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 69-70°C |
| VI-8 | 0 | i-Pr | H | H | Me | T1 | H | n _D 21. 41.4756 |
| VI-9 | 0 | 1-Et-Pr | H | H | Me | T1 | H | n _D 21. 11.5191 |
| VI-10 | 0 | 1-Et-Pr | H | H | Me | T1 | 6-Me | oil |
| VI-11 | 0 | t-Bu | H | H | Me | T1 | H | n _D 23. 51.5516 |
| VI-12 | 0 | t-Bu | H | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 19. 81.5487 |
| VI-13 | 0 | CF ₃ CH ₂ | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 86-89°C |
| VI-14 | 0 | i-Pr | H | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 21. 41.4835 |
| VI-15 | 0 | Me | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 92-93°C |
| VI-16 | 0 | Et | H | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 22. 31.5693 |
| VI-17 | 0 | Ph | H | H | Me | T1 | H | m. p. 114-115°C |
| VI-18 | 0 | Ph | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 132-133°C |
| VI-19 | 0 | Het48 | H | H | Me | T1 | H | m. p. 122-123°C |
| VI-20 | 0 | Het48 | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 100-101°C |
| VI-21 | 0 | Ph | H | H | Me | T6 | H | m. p. 184-185°C |
| VI-22 | 0 | Pr | H | H | Me | T6 | 6-Me | m. p. 107-108°C |
| VI-23 | 0 | Het23 | H | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 145-146°C |
| VI-24 | 0 | Het23 | H | H | Me | T1 | H | m. p. 119.5-120°C |
| VI-25 | 0 | Pr | H | H | Me | T13 | H | n _D 19. 61.5768 |
| VI-26 | 0 | i-Pr | H | H | Me | T6 | H | m. p. 150-151°C |

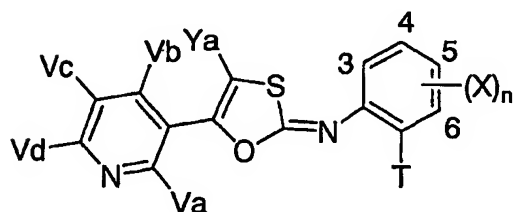
〔第 1 4 表〕



| No. | Q | Va | Vb | Vc | Vd | Ya | T | X | 物性(m. p. 等) |
|--------|---|-----|----|-----------------|----|----|----|----------------------|----------------------------|
| VII-1 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | H | m. p. 64-67°C |
| VII-2 | O | H | H | CF ₃ | H | H | T1 | H | m. p. 97-99°C |
| VII-3 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | 4-MeO | m. p. 86-86.5°C |
| VII-4 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | 4-Et | m. p. 65-65.8°C |
| VII-5 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | 4-Me | m. p. 112-113°C |
| VII-6 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 116-117°C |
| VII-7 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | 4, 6-Me ₂ | m. p. 106-107°C |
| VII-8 | O | H | Cl | H | H | Me | T1 | H | m. p. 99-100°C |
| VII-9 | O | H | H | H | H | Me | T1 | H | m. p. 75-77°C |
| VII-10 | O | H | H | H | Me | Me | T1 | H | n _D 20. 1.5154 |
| VII-11 | O | H | H | CF ₃ | H | Cl | T1 | H | oil |
| VII-12 | O | H | H | H | Cl | Me | T1 | H | m. p. 75-76°C |
| VII-13 | S | H | H | CF ₃ | H | Me | T1 | H | n _D 21. 1.6526 |
| VII-14 | O | H | H | Et | H | Me | T1 | H | n _D 19. 21.5674 |
| VII-15 | O | H | H | i-Pr | H | Me | T1 | H | n _D 19. 21.5616 |
| VII-16 | O | H | H | Bu | H | Me | T1 | H | |
| VII-17 | O | H | H | Et | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 99-100°C |
| VII-18 | O | H | H | i-Pr | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 114-115°C |
| VII-19 | O | H | H | Bu | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 21. 31.5810 |
| VII-20 | O | H | H | CF ₃ | H | Et | T1 | H | m. p. 60-61°C |
| VII-21 | O | H | H | CF ₃ | H | Et | T1 | 6-Me | m. p. 94-95°C |
| VII-22 | O | H | H | CF ₃ | H | Et | T6 | H | m. p. 143-145°C |
| VII-23 | O | H | H | Cl | H | Me | T1 | H | m. p. 74-75°C |
| VII-24 | O | H | H | Cl | H | Me | T1 | 6-Me | m. p. 69-70°C |
| VII-25 | O | H | H | CF ₃ | H | Et | T6 | 6-Me | m. p. 159-160°C |
| VII-26 | O | H | H | Cl | H | Me | T6 | H | m. p. 127-129°C |
| VII-27 | O | H | H | Cl | H | Me | T6 | 6-Me | m. p. 114-115°C |
| VII-28 | O | EtO | H | CF ₃ | H | H | T1 | H | n _D 21. 21.5907 |
| VII-29 | O | EtO | H | CF ₃ | H | H | T6 | H | m. p. 170-171°C |
| VII-30 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T6 | H | m. p. 141-143°C |
| VII-31 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T6 | 4-Me | m. p. 124-125°C |
| VII-32 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T1 | H | n _D 21. 21.5361 |
| VII-33 | O | Cl | H | Cl | H | H | T1 | H | n _D 21. 21.5679 |
| VII-34 | O | F | H | F | H | Me | T1 | H | n _D 20. 91.5233 |
| VII-35 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 21. 11.5078 |
| VII-36 | O | Cl | H | Cl | H | H | T1 | 6-Me | m. p. 92-93°C |
| VII-37 | O | F | H | F | H | Me | T1 | 6-Me | n _D 21. 21.5729 |
| VII-38 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T1 | 4-Me | n _D 21. 21.5570 |
| VII-39 | O | Cl | H | Cl | H | H | T1 | 4-Me | n _D 21. 11.5310 |

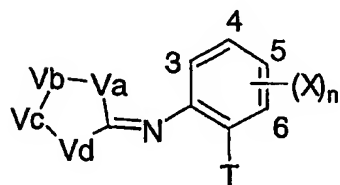
| | | | | | | | | | |
|--------|---|----|---|-----------------|---|----|----|---------------------|-----------------------------|
| VII-40 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T6 | 4,6-Me ₂ | m.p. 119-120°C |
| VII-41 | O | H | H | Cl | H | H | T1 | 6-Me | n _D 21. 41. 5319 |
| VII-42 | O | H | H | CF ₃ | H | Me | T6 | 6-Me | m.p. 158-159°C |
| VII-43 | O | H | H | Cl | H | Me | T1 | 4-Me | n _D 21. 31. 5468 |
| VII-44 | O | H | H | CF ₃ | H | H | T6 | H | m.p. 165-167°C |
| VII-45 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T6 | H | m.p. 127-129°C |
| VII-46 | O | Cl | H | Cl | H | H | T6 | H | m.p. 119-120°C |
| VII-47 | O | F | H | F | H | Me | T1 | 4-Me | n _D 20. 71. 4902 |
| VII-48 | O | Cl | H | Cl | H | H | T6 | 4-Me | m.p. 92-94°C |
| VII-49 | O | H | H | Cl | H | H | T6 | 4-Me | m.p. 132-134°C |
| VII-50 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T6 | 4-Me | m.p. 131-133°C |
| VII-51 | O | Cl | H | Cl | H | H | T6 | 6-Me | m.p. 96-98°C |
| VII-52 | O | F | H | F | H | Me | T6 | 6-Me | m.p. 85-87°C |
| VII-53 | O | Cl | H | Cl | H | Me | T6 | 6-Me | n _D 21. 21. 5058 |

〔第 1 5 表〕



| No. | Q | Va | Vb | Vc | Vd | Ya | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|--------|---|----|----|----|-----------------|----|----|---|-----------------------------|
| VIII-1 | O | H | H | H | CF ₃ | H | T1 | H | n _D 24. 21. 4715 |
| VIII-2 | O | H | H | H | CF ₃ | H | T6 | H | n _D 20. 21. 5218 |

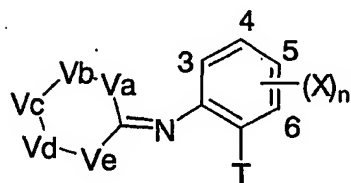
〔第 1 6 表〕



| No. | -Va-Vb-Vc-Vd- | T | X | 物性 (m. p. 等) | 備考 |
|------|---|------|---|-----------------------------|----|
| IX-1 | -S-C(=CH ₂)-CH ₂ -N(Me)- | T1 | H | n _D 21. 01. 5078 | |
| IX-2 | -S-C(=CH ₂)-CH ₂ -N(Me)- | T2-1 | H | n _D 21. 01. 4735 | |
| IX-3 | -S-C(=O)-CH ₂ -N(Me)- | T1 | H | 油状物 | |
| IX-4 | -S-CH(Me)-C(=O)-N(Me)- | T1 | H | 油状物 | |

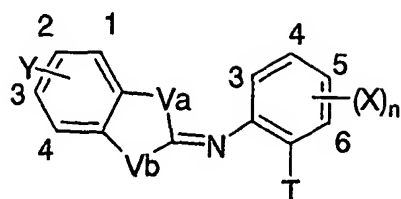
| | | | | |
|-------|--|------|---|-------------------------------------|
| IX-5 | -S-CH(Me)-C(=O)-N(Me)- | T2-1 | H | 油状物 |
| IX-6 | -S-CH ₂ -C(OH)(C ₂ F ₅)-N(Me)- | T1 | H | m.p. 178-180°C HBr塩 |
| IX-7 | -S-CH ₂ -C(=O)-N(Me)- | T1 | H | m.p. 74-75°C |
| IX-8 | -N(Me)-CH ₂ -C(=O)-N(Me)- | T1 | H | m.p. 57-59°C |
| IX-9 | -O-C(Ph)=N-N(Me)- | T1 | H | m.p. 97-99°C |
| IX-10 | -S-C(Ph)=N-N(Me)- | T1 | H | m.p. 76-77°C |
| IX-11 | -S-C(Ph)=N-N(Me)- | T2-1 | H | m.p. 127-129°C |
| IX-12 | -S-C(Ph)=N-N(Me)- | T2-2 | H | m.p. 97-98°C |
| IX-13 | -S-CH(CH ₂ Br)-CH ₂ -N(Me)- | T1 | H | m.p. 177-179°C HBr塩 |
| IX-14 | -S-CH ₂ -CH(Ph)-O- | T1 | H | 粘稠油状物 |
| IX-15 | -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)- | T1 | H | n _D ²¹ 1.4973 |
| IX-16 | -S-CH ₂ -C(=N-Ph)-N(Me)- | T1 | H | n _D ²⁰ 1.5326 |
| IX-17 | -O-CH=C(Ph)-N(Me)- | T1 | H | 粘稠油状物 |
| IX-18 | -S-C(Cl ₂)-C(=O)-N(Me)- | T1 | H | n _D ²¹ 1.6031 |
| IX-19 | -S-CH ₂ -C(=N-(2,6-F ₂ -Ph))-N(Me)- | T1 | H | m.p. 78-79°C |
| IX-20 | -S-CH ₂ -CH(4-Br-Ph)-O- | T1 | H | n _D ²² 1.5656 |
| IX-21 | -S-CH ₂ -CH(4-F-Ph)-O- | T1 | H | n _D ²² 1.5710 |

〔第 17 表〕



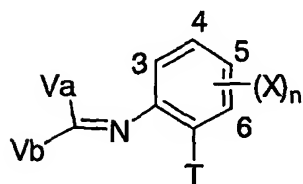
| No. | -Va-Vb-Vc-Vd-Ve- | T | X | 物性(m.p.等) |
|------|--|------|---|-------------------------------------|
| X-1 | -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Ph)- | T1 | H | n _D ²¹ 1.5728 |
| X-2 | -S-CH ₂ -C(Ph)=N-N(Me)- | T1 | H | m.p. 85-86°C |
| X-3 | -N(Me)-CH ₂ =CH-CH(Ph)-S- | T1 | H | n _D ²¹ 1.6292 |
| X-4 | -N=C(OMe)-CH=C(OMe)-N(Me)- | T1 | H | m.p. 122-123°C |
| X-5 | -CH=CH-CH=C(F)-N(Me)- | T1 | H | n _D ²¹ 1.5286 |
| X-6 | -S-CH ₂ -C(Me)=N-N(Ph)- | T1 | H | m.p. 101-104°C |
| X-7 | -CH=CH-CH=CH-N(-OMe)- | T1 | H | n _D ²¹ 1.5728 |
| X-8 | -S-CH ₂ -C(=O)-N(Me)-N(Me)- | T1 | H | n _D ²⁰ 1.5728 |
| X-9 | -CH ₂ -S-CH=C(Ph)-N(Me)- | T1 | H | n _D ²⁰ 1.6251 |
| X-10 | -CH ₂ -S-CH=C(Ph)-N(Me)- | T2-1 | H | 粘稠油状物 |

〔第 18 表〕



| No. | Va | Vb | Y | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|------|-----|-----|-------|----|---|-------------------|
| XI-1 | S | NMe | H | T1 | H | $n_D^{21} 1.5512$ |
| XI-2 | O | NMe | H | T1 | H | $n_D^{21} 1.5526$ |
| XI-3 | S | S | H | T1 | H | $n_D^{21} 1.5032$ |
| XI-4 | S | NMe | 2-Cl | T1 | H | $n_D^{21} 1.5232$ |
| XI-5 | S | NMe | 2-MeO | T1 | H | $n_D^{21} 1.5276$ |
| XI-6 | NMe | NMe | H | T1 | H | $n_D^{21} 1.5380$ |
| XI-7 | S | O | H | T1 | H | $n_D^{21} 1.5459$ |

〔第 19 表〕



| No. | Va | Vb | T | X | 物性 (m. p. 等) |
|--------|--|-------------------|----|---|-------------------|
| XII-1 | PhC(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.6084$ |
| XII-2 | (2-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5325$ |
| XII-3 | (3-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5274$ |
| XII-4 | (4-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5053$ |
| XII-5 | (3-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.4970$ |
| XII-6 | (4-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5545$ |
| XII-7 | (2-F-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5166$ |
| XII-8 | (3-F-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5544$ |
| XII-9 | (4-F-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5281$ |
| XII-10 | (2-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5382$ |
| XII-11 | (3-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5022$ |
| XII-12 | (4-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5221$ |
| XII-13 | (2,6-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5647$ |
| XII-14 | (2-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5364$ |
| XII-15 | (1-naphthyl)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5342$ |
| XII-16 | (2,5-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{21} 1.5860$ |
| XII-17 | (4-NO ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{20} 1.5216$ |
| XII-18 | (2-Br-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{20} 1.5756$ |
| XII-19 | (4-MeS-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | $n_D^{20} 1.5932$ |

| | | | | | |
|--------|---|-------------------------------------|----|---|---------------|
| XII-20 | (2,6-Me ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 51.5232 |
| XII-21 | (4-PhO-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 41.6214 |
| XII-22 | (4-Hex-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 51.5778 |
| XII-23 | (4-Bu-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 41.5884 |
| XII-24 | (4-Pr-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 41.5936 |
| XII-25 | (4-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND21. 51.5592 |
| XII-26 | (2,4-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND21. 51.5104 |
| XII-27 | (4-CF ₃ O-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND21. 71.5640 |
| XII-28 | (4-CF ₃ -Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND21. 81.5653 |
| XII-29 | (4-Et-Ph)C(=O)CH ₂ S | Me ₂ N | T1 | H | ND20. 81.5790 |
| XII-30 | MeS | Me ₃ SiCH ₂ S | T1 | H | ND21. 01.5676 |
| XII-31 | MeS | PhCH(OH)CH ₂ S | T1 | H | 粘稠油状物 |

〔第20表〕

| No. | ¹ H NMR (CDCl ₃ δ (ppm)) |
|-------|---|
| I-50 | 2.38(s, 3H), 3.26(s, 3H), 3.58(s, 3H), 3.73(s, 3H), 5.71(s, 1H), 6.80-7.60(m, 9H) |
| I-51 | 2.39(s, 3H), 3.28(s, 3H), 3.55(s, 3H), 3.85(s, 3H), 5.70(s, 1H), 6.54(s, 1H), 6.90-7.40(m, 8H) |
| I-52 | 3.23(s, 3H), 3.56(s, 3H), 3.74(s, 3H), 5.73(s, 1H), 6.90-7.80(m, 9H) |
| I-53 | 3.28(s, 3H), 3.59(s, 3H), 3.86(s, 3H), 5.75(s, 1H), 6.56(s, 1H), 6.80-7.60(m, 8H) |
| I-54 | 3.31(s, 3H), 3.59(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.79(s, 1H), 7.10-7.85(m, 14H) |
| I-58 | 3.30(s, 3H), 3.60(s, 3H), 3.90(s, 3H), 5.90(s, 1H), 6.55(s, 1H), 7.00-8.15(m, 11H) |
| I-59 | 3.38(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.78(s, 3H), 5.94(s, 1H), 7.00-7.60(m, 8H) |
| I-76 | 2.94(s, 3H), 3.32(s, 3H), 3.54(s, 3H), 3.82(s, 3H), 4.20(s, 2H), 5.57(s, 1H), 6.49(s, 1H), 6.65-7.45(m, 9H) |
| I-79 | 3.19(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.67(s, 2H), 5.85(s, 1H), 7.00-7.80(m, 7H) |
| I-118 | 3.24(s, 3H), 3.51(s, 3H), 3.76(s, 3H), 5.63(s, 1H), 6.45(s, 1H), 6.60-7.60(m, 13H) |
| I-123 | 3.43(s, 3H), 3.55(s, 3H), 3.73(s, 3H), 6.00(s, 1H), 6.35-6.65(m, 2H), 6.90-7.60(m, 6H) |
| I-124 | 3.56(s, 3H), 3.63(s, 3H), 3.75(s, 3H), 6.28(s, 1H), 7.10-7.45(m, 6H), 7.86(d, J=3.6Hz, 1H) |
| I-129 | 3.22(s, 3H), 3.53(s, 3H), 3.72(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.50(m, 8H) |
| I-130 | 3.25(s, 3H), 3.54(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.49(s, 1H), 6.80-7.55(m, 7H) |
| I-132 | 3.08(s, 3H), 3.52(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.82(s, 1H), 6.53(s, 1H), 6.80-7.55(m, 7H) |
| I-134 | 3.12(s, 3H), 3.52(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.75(s, 1H), 6.50(s, 1H), 6.90-7.55(m, 7H) |
| I-138 | 3.17(s, 3H), 3.60(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.53(s, 1H), 6.85-7.75(m, 9H) |
| I-152 | 3.92(s, 3H), 3.35(s, 3H), 3.57(s, 3H), 3.61(s, 2H), 4.20(s, 2H), 5.61(s, 1H), 6.75-7.45(m, 9H) |
| I-161 | 0.94(t, J=5.4Hz, 3H), 1.20-1.75(m, 4H), 2.2-2.6(m, 2H), |

| | |
|--------|---|
| | 3.30 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.42 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.85-7.35 (m, 4H) |
| I-168 | 3.44 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 6.44 (s, 1H), 7.05-7.35 (m, 4H), 7.38 (s, 1H) |
| I-169 | 3.47 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.05-7.35 (m, 4H) |
| I-171 | 3.49 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 5.98 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.90-7.55 (m, 7H) |
| I-173 | 3.23 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 5.91 (s, 1H), 6.85-7.45 (m, 10H) |
| I-174 | 3.31 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 5.99 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 7.05-7.50 (m, 9H) |
| I-175 | 2.91 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.17 (s, 2H), 5.57 (s, 1H), 6.70-7.45 (m, 10H) |
| I-177 | 2.10 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.00 (s, 1H), 6.90-7.70 (m, 9H) |
| I-178 | 2.10 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.10 (s, 1H), 6.90-7.50 (m, 9H) |
| I-179 | 0.55-1.15 (m, 4H), 1.40-1.70 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.43 (s, 1H), 6.95-7.50 (m, 5H) |
| I-181 | 2.05 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.44 (s, 2H), 3.55 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.68 (s, 1H), 6.95-7.37 (m, 5H) |
| I-183 | 2.04 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 6.85-7.65 (m, 9H) |
| I-184 | 2.03 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 6.50 (s, 1H), 6.90-7.45 (m, 8H) |
| I-190 | 3.30 (s, 3H), 3.60 (s, 3H), 3.62 (s, 2H), 5.82 (s, 1H), 6.92-7.45 (m, 8H) |
| I-224 | 3.57 (s, 8H), 6.16 (s, 1H), 6.90-7.60 (m, 6H) |
| I-231 | 3.48 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 5.12 (d, J=48.4Hz, 2H), 6.06 (d, J=6.6Hz, 1H), 7.00-7.10 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H) |
| I-286 | 3.41 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 5.92 (s, 1H), 6.99-7.96 (m, 13H) |
| II-9 | 3.64 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.59 (s, 0.4H), 6.68 (s, 0.6H), 7.04-7.32 (m, 9H) |
| II-19 | 3.66 (s, 3H), 3.72 (s, 2H), 6.37 (s, 1H), 7.10-8.35 (m, 11H) |
| II-33 | 1.34 (s, 9H), 3.62 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 6.33 (s, 1H), 7.05-7.65 (m, 8H) |
| II-38 | 3.61 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 6.27 (s, 1H), 6.95-7.7 (m, 13H) |
| II-54 | 3.65 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 6.9-8.15 (m, 9H) |
| II-63 | 3.67 (s, 2H), 3.70 (s, 3H), 7.05-7.32 (m, 14H) |
| II-102 | 3.64 (s, 5H), 6.84 (s, 0.4H), 6.94 (s, 0.6H), 7.03-7.33 (m, 7H) |
| II-118 | 3.70 (s, 5H), 6.45 (s, 0.4H), 6.54 (s, 0.6H), 6.90-8.19 (m, 11H) |
| II-142 | 1.97 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 7.05-7.51 (m, 7H) |
| II-151 | 3.61 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.25 (s, 1H), 6.85-7.55 (m, 7H), 8.53 (s, 1H), 8.67 (s, 1H) |
| II-198 | 1.05-1.24 (m, 3H), 2.36-2.58 (m, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.66 (s, 3H), 6.98-7.38 (m, 8H) |
| II-199 | 2.07 (s, 1.2H), 2.17 (s, 1.8H), 3.64 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 7.00-7.65 (m, 8H) |
| II-218 | 2.08 (s, 1.2H), 2.17 (s, 1.8H), 3.64 (s, 2H), 3.68 (s, 3H), 6.98-7.50 (m, 8H) |
| II-226 | 2.07 (s, 1.2H), 2.16 (s, 1.8H), 2.26 (s, 1.8H), 2.30 (s, 1.8H), 3.64 (s, 2H), 3.68 (s, 3H), 6.90-7.35 (m, 7H) |
| II-256 | 2.27 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.81 (s, 2H), 6.82-7.00 (m, 3H), 7.71 (m, 4H) |

| | |
|--------|--|
| II-259 | 1.95 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 6.85-7.60 (m, 12H) |
| II-269 | 1.80 (m, 4H), 2.76 (m, 4H), 3.64 (s, 5H), 6.52 (s, 0.4H), 6.61 (s, 0.6H), 7.05-7.70 (m, 7H) |
| II-270 | 2.27 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.89 (s, 2H), 6.98-7.27 (m, 3H), 7.70 (m, 4H) |
| II-272 | 2.21 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 6.86-7.49 (m, 8H) |
| II-304 | 2.20 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 7.23 (d, J=7.6Hz, 2H), 7.47 (d, J=7.6Hz, 2H) |
| II-305 | 2.27 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 6.72 (s, 1H), 6.81 (s, 1H), 7.70 (m, 4H) |
| II-311 | 3.29 (s, 9H), 3.58 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.90-7.50 (m, 4H) |
| II-313 | 2.15 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.57 (s, 2H), 3.61 (s, 3H), 6.55 (m, 2H), 7.08 (m, 1H), 7.20 (d, J=8.0Hz, 2H), 7.42 (d, J=8.0Hz, 2H) |
| II-321 | 2.23 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.63 (s, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.56 (d, J=8.3Hz, 1H), 6.66 (br, s, 1H), 7.10 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.67 (m, 4H) |
| II-325 | 2.09 (d, J=2.8Hz, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.74 (s, 2H), 6.87-7.74 (m, 6H) |
| II-341 | 2.09 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 6.65-7.74 (m, 6H) |
| II-343 | 2.29 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.73 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.00 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.28 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.71 (m, 4H) |
| II-344 | 2.22 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.73 (s, 2H), 6.98-7.48 (m, 7H) |
| II-345 | 2.23 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 3.73 (s, 3H), 6.92-7.54 (m, 7H) |
| II-347 | 2.31 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 3.75 (s, 1H), 7.02 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.29 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.72 (m, 4H) |
| II-383 | 1.23 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.63 (s, 2H), 6.89 (s, 1H), 6.96 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.21 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.43-7.66 (m, 3H) |
| II-397 | 2.40 (s, 3H), 3.65 (m, 3H), 3.67 (s, 2H), 6.95-7.88 (m, 4H) |
| II-420 | 1.02 (s, 9H), 2.33 (s, 2H), 3.60 (s, 2H), 3.63 (s, 3H), 5.73 (s, 1H), 6.91 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.38 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.42 (s, 1H) |
| II-427 | 2.46 (s, 3H), 3.11 (s, 1H), 3.50 (m, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.66 (m, 1H), 6.98-7.31 (m, 4H) |
| II-520 | 1.48 (t, J=7.2Hz, 3H), 2.07 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 4.63 (q, 7.2Hz, 2H), 7.00-7.35 (m, 4H), 8.74 (s, 1H) |
| II-594 | 2.21 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 7.00-7.45 (m, 8H), 7.51 (s, 1H) |
| II-595 | 2.18 (s, 0.9H), 2.21 (s, 2.1H), 2.38 (s, 3H), 2.92 (d, J=4.7Hz, 0.9H), 2.98 (d, J=4.7Hz, 2.1H), 3.56 (s, 2.1H), 3.62 (s, 0.9H), 6.74 (d, J=13.2Hz, 1H), 7.00-8.10 (m, 9H) |
| II-596 | 2.28 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 7.20-7.55 (m, 4H), 7.68 (m, 4H) |
| II-597 | 2.19 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 4.75 (d, J=12Hz, 1H), 5.15 (d, J=12Hz, 1H), 6.90-7.50 (m, 7H) |
| II-599 | 2.22 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.33 (br, 1H), 6.93-7.52 (m, 7H) |

| | |
|--------|--|
| II-600 | 2.28(s, 3H), 3.20(s, 3H), 3.60(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H) |
| II-601 | 2.28(s, 3H), 3.40(s, 3H), 3.90(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H) |
| II-604 | 2.08(s, 1.5H), 2.14(s, 1.5H), 2.36(s, 3H), 3.45(s, 3H), 3.66(s, 3H), 4.75(br, 1H), 5.30(br, 1H), 7.05-7.35(m, 8H) |
| II-607 | 1.20-1.60(br, 9H), 2.21(s, 3H), 2.39(s, 3H), 3.42(s, 3H), 4.65-5.29(br, 2H), 7.05-7.50(m, 8H) |
| III-30 | 3.17(s, 3H), 3.80(s, 3H), 5.85(s, 1H), 6.85-7.60(m, 8H) |
| III-32 | 3.34(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.60(m, 10H) |
| IV-18 | 2.09(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.64(s, 2H), 3.64(s, 3H), 6.82(s, 1H), 7.02-7.30(m, 5H) |
| IV-68 | 2.39(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.73(s, 2H), 4.03(s, 3H), 6.85-6.91(m, 2H), 6.91(s, 1H), 7.19-7.25(m, 1H) |
| IV-70 | 2.38(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.88(s, 2H), 4.03(s, 3H), 6.91(s, 1H), 6.97-6.99(m, 1H), 7.19-7.22(m, 2H) |
| IV-72 | 1.01(t, J=7.2Hz, 3H), 2.38(s, 3H), 2.39(s, 3H), 3.19(q, J=6.7Hz, 2H), 3.60(s, 2H), 4.04(s, 3H), 6.00(br, 1H), 6.92(d, J=6.4Hz, 1H), 6.91(s, 1H), 7.02(d, J=7.6Hz, 1H), 7.18(t, J=7.6Hz, 1H) |
| IV-83 | 2.40(s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.05(s, 3H), 6.92(s, 1H), 7.02(t, J=7.6Hz, 1H), 7.11(d, J=8.0Hz, 1H), 7.16(t, J=7.6Hz, 1H), 7.47(br, 1H), 8.18(d, J=7.2Hz, 1H) |
| IV-90 | 2.92(s, 3H), 2.41(s, 3H), 3.76(s, 3H), 4.04(s, 3H), 6.92(s, 1H), 6.96(d, J=8.1Hz, 1H), 7.33(br, 1H), 8.03(d, J=8.1Hz, 1H) |
| IV-92 | 2.35(s, 0.9H), 2.38(s, 2.1H), 2.92(d, J=10.2Hz, 0.9H), 2.98(d, J=4.8Hz, 2.1H), 3.54(s, 2.1H), 3.61(s, 0.9H), 6.60-8.00(m, 7H) |
| IV-94 | 2.19(s, 3H), 2.27(s, 3H), 3.46(s, 3H), 3.64(s, 3H), 4.03(s, 3H), 4.75(d, J=12Hz, 1H), 5.12(d, J=12Hz, 1H), 6.90-7.25(m, 4H) |
| V-3 | 2.09(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.66(s, 2H), 3.93(s, 3H), 7.05-7.33(m, 4H) |
| VI-10 | 0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.81-1.95(m, 4H), 2.19(s, 3H), 2.30(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.72(s, 2H), 3.85-4.00(m, 1H), 6.90-8.05(m, 5H) |
| VII-11 | 3.64(s, 3H), 3.68(s, 2H), 7.02-8.04(m, 6H), 8.83(s, 1H) |
| VII-16 | 0.95(t, J=6.8Hz, 3H), 1.37(m, 2H), 1.63(m, 2H), 2.56(s, 1H), 2.64(t, J=7.7Hz, 2H), 3.63(s, 1H), 3.68(s, 3H), 7.00-7.70(m, 6H), 8.43(s, 1H) |
| IX-3 | 3.09(s, 3H), 3.51(s, 2H), 3.61(s, 3H), 4.00(s, 2H), 7.05-7.48(m, 4H) |
| IX-4 | 1.61(d, J=7.2Hz, 3H), 3.30(s, 3H), 3.57(s, 2H), 3.62(s, 3H), 4.08(q, J=7.2Hz, 1H), 6.90-7.45(m, 4H) |
| IX-5 | 1.58(d, J=7.8Hz, 3H), 3.21(s, 3H), 3.63(s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.05(q, J=7.8Hz, 1H), 6.85-7.40(m, 5H) |
| IX-14 | 3.38(dd, J=9.1, 11.0Hz, 1H), 3.60-3.65(m, 1H), 3.65(s, 3H), 3.66(s, 2H), 5.63(dd, J=5.8, 9.1Hz, 1H), 6.96-7.46(m, 9H) |
| IX-17 | 3.28(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.73(s, 2H), 6.81(s, 1H), 6.95-7.5(m, 9H) |
| X-10 | 3.03(s, 3H), 3.25(s, 2H), 3.69(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.71(s, 1H), 6.79-7.41(m, 10H), 7.46(s, 1H) |

〔試験例〕 本発明に係る化合物の有用性について、以下の試験例において具体

的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

〔試験例１〕 イネいもち病防除効果試験（水面施用）

1 / 2 万アールのピーカーポットに植えた 1. 5 葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈し 5 0 0 p p m に調製した薬液を 1 ポット当たり 1 0 m l 灌注処理した。

灌注処理 7 日後、処理したイネに、いもち病菌（*P y r i c u l a r i a o r y z a e*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個 / m l）を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度 2 0 ~ 2 5 ℃、湿度 9 5 % 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 7 0 以上を示した。

本発明化合物 N o . : I-1 ~ I-4, I-7, I-13, I-17, I-20, I-21, I-33, I-37, I-41, I-43 ~ I-45, I-47, I-50 ~ I-52, I-54 ~ I-59, I-64, I-66, I-68, I-70 ~ I-73, I-75, I-80, I-82, I-99, I-111, I-128, I-131, I-134, I-143, I-144, I-146, I-151, I-160, I-162, I-164, I-166 ~ I-169, I-175, I-176, I-181, I-196 ~ I-198, I-203 ~ I-205, I-244, I-246, I-292, II-5, II-6, II-8, II-9, II-32, II-36, II-37, II-123, II-129, II-136, II-463, I-480, II-502, III-4, III-10 ~ III-12, III-19, III-33, III-36, IV-55, IV-65, IV-67, IV-69, IV-74 ~ IV-79, VII-27, VII-30, VIII-1, VIII-2, IX-2, IX-3, IX-5, X-3, XII-18

〔試験例２〕 イネいもち病防除効果試験（散布試験）

直径 7 c m のポットで育成した 3 葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 5 0 0 p p m に調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 2 0 m l 散布した。

散布翌日イネいもち病菌（*P y r i c u l a r i a o r y z a e*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個 / m l）を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度 2 5 ℃、湿度 9 5 % 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除

価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1~I-6, I-8~I-21, I-25~I-31, I-33, I-36~I-72, I-74, I-76, I-79, I-80, I-82, I-92~I-94, I-98~I-100, I-102, I-105~I-117, I-119, I-126~I-129, I-133, I-134, I-137, I-139~I-141, I-143~I-146, I-149, I-150, I-152, I-155, I-160~I-162, I-164~I-166, I-168, I-169, I-171, I-175, I-176, I-179, I-183, I-186, I-187, I-196~I-198, I-201, III-1~III-4, III-12, III-32, IX-10

〔試験例 3〕 コムギうどんこ病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0~2.5 葉期のコムギ（品種：農林 61 号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布 1 日後、コムギうどんこ病菌（*Erysiphe graminis*）の胞子を直接接種した。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1, I-3~I-6, I-9~I-13, I-15, I-16, I-18, I-20~I-28, I-31, I-37, I-41, I-43, I-45, I-49, I-50, I-52, I-56, I-59, I-62, I-66~I-68, I-70, I-72, I-73, I-76, I-78~I-80, I-84~I-90, I-92~I-97, I-106, I-111, I-113, I-115, I-120, I-125, I-127, I-129, I-130, I-132, I-135, I-143, I-145~I-147, I-151, I-155, I-160, I-161, I-164, I-166, I-168, I-169, I-177, I-178, I-188, I-190, I-191, I-193~I-195, I-197, I-198, I-200, I-201, I-203, I-205~I-208, I-210~I-215, I-218~I-220, I-223~I-226, I-228, I-229, I-234, I-240, I-242~I-244, I-248, I-249, I-251~I-254, I-257, I-258, I-264~I-267, I-270~I-274, I-276~I-279, I-281, I-288~I-290, I-292~I-294, I-298~I-301, I-303, I-304, II-1~II-5, II-7~II-21, II-24~II-28, II-30~II-62, II-64~II-150, II-152~II-162, II-166~II-179, II-182~II-

187, II-189~II-191, II-193~II-210, II-212, II-213, II-215~II-258, II-260~II-264, II-266, II-268~II-273, II-276, II-279~II-290, II-292~II-307, II-309, II-310, II-312, II-317~II-325, II-328~II-330, II-332~II-335, II-337~II-342, II-346, II-348, II-350, II-352~II-363, II-365, II-366, II-368~II-373, II-375, II-376, II-378, II-380~II-385, II-387~II-395, II-397~II-399, II-401, II-403~II-405, II-407~II-410, II-416, II-418, II-419, II-421, II-423~II-426, II-428, II-430, II-433~II-435, II-439~II-441, II-448~II-456, II-459~II-461, II-463, II-468~II-472, II-474~II-477, II-479~II-481, II-483~II-485, II-487~II-490, II-492~II-501, II-514~II-517, II-519~II-525, II-528, II-530~II-533, II-535, II-551~II-553, II-555, II-557~II-559, II-563, II-565, II-567, II-572, II-574, II-577, II-579, II-585, II-586, II-592, II-594, III-1, III-2, III-25, III-26, III-30, III-33, III-35, III-38, IV-1~IV-8, IV-11~IV-17, IV-19, IV-21~IV-34, IV-36, IV-37, IV-40~IV-53, IV-55~IV-58, IV-60~IV-62, IV-64~IV-66, IV-68~IV-70, IV-75~IV-79, IV-83, IV-84, IV-87, IV-89~IV-91, IV-93, V-1~V-9, V-11, V-15~V-17, V-20, V-22~V-26, VI-2, VI-4~VI-8, VI-11, VI-12, VI-14~VI-17, VI-24, VII-1~VII-10, VII-12~VII-21, VII-23~VII-27, VII-30, VII-34, VII-37, VII-38, VII-40, VII-42, VII-50, VIII-1, IX-1, IX-2, IX-5, IX-7, IX-14, IX-19~IX-21, XI-1, XI-3, XI-7, XII-1~XII-14, XII-16, XII-18, XII-22~XII-24, XII-29

〔試験例 4〕 コムギ赤さび病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0~2.5 葉期のコムギ（品種：農林 61 号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布 1 日後、コムギ赤さび病菌（*Puccinia recondita*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個/ml）を噴霧し、温度 20~25℃、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種 10 日後に形成された病斑面積を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1~I-16, I-18~I-21, I-24~I-31, I-33, I-35~I-57, I-59, I-60, I-62~I-74, I-76~I-80, I-82~I-89, I-91~I-100, I-102, I-104~I-112, I-114~I-121, I-123~I-137, I-139, I-143~I-149, I-151~I-153, I-155, I-160~I-168, I-170, I-171, I-173~I-183, I-187~I-191, I-193~I-200, I-203, I-205~I-209, I-211, I-212, I-214~I-221, I-223~I-230, I-232~I-234, I-236, I-238~I-276, I-278~I-290, I-292~I-305, II-1~II-62, II-64~II-150, II-152~II-163, II-164~II-197, II-199~II-213, II-215~II-266, II-268~II-274, II-276, II-279~II-310, II-313, II-315~II-333, II-335~II-346, II-348~II-351, II-353~II-366, I-368~II-373, II-375~II-402, II-404~II-410, II-413~II-419, II-421~II-426, II-428~II-436, II-438~II-441, II-448~II-457, II-459~II-461, II-463~I-466, II-468~II-482, II-484~II-506, II-508~II-511, II-514~II-533, II-535, I-538~II-540, II-542, II-544, II-549~II-555, II-557~II-560, II-563, II-565~II-568, II-570, II-572, II-574, II-577, II-579, II-585, II-586, II-592, II-594, III-1, III-2, III-4, III-5, III-12, III-16~III-18, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28~III-30, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, III-43, IV-1~IV-66, I-68~IV-79, IV-81, IV-83~IV-85, IV-87, IV-89~IV-91, IV-93, V-1~V-12, V-14~V-26, VI-1~VI-24, VII-1~VII-10, VII-12~VII-27, VII-30~VII-38, VII-40~VII-43, VII-45, VII-47, VII-50, VII-51, VII-53, VIII-1, VIII-2, IX-6, IX-14, IX-19~IX-21, X-10, XI-1~XI-3, XI-5, XI-7, XII-1~XII-7, XII-9~XII-16, XII-18, XII-19, XII-23~XII-26, XII-29

〔試験例5〕 コムギふ枯れ病防除試験

直径5.5cmのポットで育成した2.0~2.5葉期のコムギ（品種：アルトリア）に、本発明化合物の乳剤を水で希釈して500ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポットあたり20ml散布処理した。

散布1日後、ふ枯れ病菌（*Leptosphaeria nodorum*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個/ml）を噴霧し接種を行った。接種を行ったコムギを温度18~20℃、湿度95%以上の接種箱に7~10日間入れ発病を促進させた。形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

防除価＝〔1－（処理区病斑面積率／無処理区病斑面積率）〕×100

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1～I-28, I-31, I-33, I-34, I-36, I-37, I-39～I-50, I-52, I-54～I-71, I-73～I-76, I-78～I-80, I-82～I-91, I-93, I-96, I-97, I-99, I-100, I-102, I-103, I-105～I-110, I-112～I-121, I-123, I-125～I-130, I-132～I-137, I-143, I-145～I-147, I-149, I-150, I-153, I-155, I-160～I-162, I-164～I-170, I-172, I-174, I-175, I-177, I-179, I-182, I-183, I-187～I-191, I-193～I-195, I-197～I-201, I-203～I-212, I-215～I-221, I-223～I-226, I-228～I-236, I-239～I-254, I-256～I-258, I-260, I-261, I-264～I-279, I-281～I-283, I-286, I-287, I-289, I-290, I-292～I-296, I-299～I-304, II-1～II-45, II-47～II-62, II-64～II-106, II-108～II-150, II-152～II-162, II-164～II-187, II-189～II-213, II-215～II-258, II-260, II-262～II-264, II-266, II-268～II-274, II-276, II-279～II-310, II-313, II-317～II-325, II-328～II-342, II-346, II-348～II-366, II-368～II-395, II-397～II-399, II-401, II-403～II-410, II-413～II-419, II-421～II-430, II-432～II-434, II-436, II-438～II-441, II-448～II-452, II-454～II-461, II-463～II-466, II-468～II-482, II-484～II-506, II-508～II-511, II-514～II-533, II-535～II-543, II-548～II-555, II-557～II-559, II-563, II-565～II-569, II-571～II-577, II-579, II-583～II-587, II-590, II-592, II-594, II-595, III-1～III-5, III-12, III-14, III-16, III-19, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28～III-30, III-32, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, IV-1, IV-2, IV-4～IV-38, IV-40～IV-53, IV-55～IV-58, IV-60～IV-79, IV-81, IV-83～IV-85, IV-87, IV-89～IV-93, V-1～V-13, V-15～V-18, V-21, V-23～V-26, VI-1～VI-24, VII-1～VII-10, VII-12～VII-28, VII-30～VII-43, VII-45, VII-47, VII-50, VII-51, VII-53, VIII-1, VIII-2, IX-1, IX-5, IX-14, IX-15, IX-19～IX-21, X-6, X-7, XI-1～XI-5, XI-7, XII-2～XII-16, XII-18, XII-19, XII-29

〔試験例6〕 キュウリベと病防除効果試験

直径7cmのポットで育成した1.5葉期のキュウリ（品種：相模半白）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり20ml散布した。

散布1日後、キュウリべと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の孢子懸濁液 (2×10^5 個/ml) を噴霧し、温度20～25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種7日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = \{ 1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率}) \} \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1, I-3, I-6, I-9～I-13, I-16～I-21, I-23, I-25, I-28, I-33, I-37, I-38, I-43～I-49, I-51～I-57, I-59, I-62, I-64～I-66, I-68, I-70～I-72, I-74, I-76, I-80, I-81, I-87, I-89, I-91, I-92, I-102, I-107, I-109～I-111, I-113～I-115, I-117～I-120, I-125, I-127～I-129, I-131, I-133～I-137, I-139, I-140, I-144, I-145, I-147, I-149, I-155, I-161～I-169, I-171～I-173, I-175～I-179, I-181, I-183, I-187～I-191, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-208, I-211, I-217～I-220, I-223, I-225, I-228, I-229, I-232, I-236, I-239～I-241, I-244, I-245, I-247, I-248, I-252, I-253, I-258, I-264, I-268, I-270, I-274～I-276, I-292～I-295, II-2, II-4～II-16, II-18～II-22, II-24, II-28～II-31, II-33, II-35, II-38, II-41～II-43, II-47, II-48, II-53, II-55～II-57, II-59～II-61, II-65～II-73, II-75, II-79, II-83, II-84, II-89, II-90, II-92, II-94～II-96, II-98～II-101, II-106, II-111, II-114, II-119, II-121, II-123, II-125, II-127～II-135, II-137, II-139～II-149, II-153, II-155～II-161, II-165, II-169～II-172, II-174, II-175, II-177, II-179, II-180, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, II-193, II-195, II-196, II-198, II-200, II-201, II-203, II-205～II-213, II-215～II-217, II-219, II-221～II-244, II-246～II-252, II-255～II-258, II-260, II-262, II-266, II-268, II-270, II-271, II-273, II-274, II-276, II-279～II-290, II-292～II-297, II-299～II-305, II-307～II-310, II-313, II-317～II-319, II-321, II-324, II-325, II-328～II-333, II-337～II-339, II-341, II-342, II-346, II-348～II-351, II-354, II-356～II-365, II-368, II-372, II-373, II-375, II-376, II-378, II-380～II-391, II-393, II-394, II-398, II-399, II-404, II-405, II-407～II-411, II-414, II-415, II-417, II-419, II-421, II-

424~II-426, II-428, II-434~II-441, II-448~II-454, II-456, II-457, II-459, II-460, II-463, II-471, II-474, II-475, II-477~II-481, II-484, II-485, II-487~II-494, II-496~II-502, II-504, II-506, II-508, II-509, II-511, II-512, II-514~II-521, II-523~II-538, II-540, II-542, II-543, II-545, II-548~II-559, II-563, II-565~II-568, III-2, III-35, III-43, IV-1~IV-5, IV-7, IV-8, IV-11~IV-16, IV-19~IV-23, IV-25~IV-36, IV-38, IV-41~IV-45, IV-47~IV-49, IV-51, IV-52, IV-55~IV-57, IV-60~IV-65, IV-69, IV-72, IV-74~IV-79, IV-81, IV-83~IV-85, V-1, V-2, V-6, V-7, V-9, V-15~V-17, V-21, V-22, VI-1, VI-2, VI-4~VI-6, VI-8~VI-15, VII-1~VII-9, VII-14~VII-27, VII-30~VII-34, VII-36~VII-38, VII-40~VII-43, VII-45~VII-47, VIII-1, VIII-2, IX-2, IX-18, IX-19, XI-3, XII-2, XII-25

〔試験例 7〕 トビイロウンカに対する殺虫試験

本発明化合物の 5 % 乳剤（化合物によって 2.5 % 水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm 濃度の薬液に調製した。

この薬液を 1/20,000 アールのポットに植えたイネの茎葉に十分量散布した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの 2 令幼虫をポット当たり、10 頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管した。調査は 6 日経過後に行い死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は 2 区制で行なった。

$$\text{死虫率 (\%)} = [\text{死虫数} / (\text{死虫数} + \text{生存虫数})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が 70 % 以上の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-50, I-184, I-270, I-275, I-276, I-277, II-65, II-67, II-81, II-98, II-131, II-155, II-158, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, VII-6

〔試験例 8〕 ツマグロヨコバイに対する殺虫試験

本発明化合物の 500 ppm 濃度の乳化液中に稲の茎葉を約 10 秒間浸漬し、この茎葉をガラス円筒に入れ、有機リン系殺虫剤に抵抗性を示すツマグロヨコバイ成虫を放ち、孔のあいた蓋をして 25℃ の恒温室に収容し、6 日後の死虫数を調査し、試験例 7 と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は 2 区制でおこなった。その結果、以下の化合物が 70 % 以上の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-10, I-11, I-16, I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55,

I-68, I-72, I-83, I-88, I-89, I-91, I-109, I-113, I-137, I-160, I-162, I-166, I-168, I-197, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-275, I-290, I-292, II-55, II-65, II-81, II-84, II-91, II-98, II-106, II-114, II-125, II-131, II-132, II-153, II-155, II-157~II-160, II-175, II-177, II-179, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, II-193, II-198, II-206~II-208, II-210, II-213, II-215~II-217, II-219, II-463, III-5, VII-6, IX-12

〔試験例 9〕コナガに対する接触性殺虫試験

本発明化合物の 500 ppm 濃度の水乳化液中にカンランの葉を約 10 秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ 2 令幼虫をシャーレ当たり 10 頭ずつ放ち、孔のあいた蓋をして 25℃の恒温室に収容し、6 日後の死虫数を調査し、試験例 7 と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は 2 区制でおこなった。その結果、以下の化合物が 70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-37, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-63, I-88, I-89, I-96, I-109, I-113, I-119, I-125, I-129, I-137, I-203, I-208, I-220, I-257, I-258, I-270, I-275, I-276, I-277, I-279, I-281, II-55, II-67, II-91, II-113, II-114, II-121, II-125, II-127, II-130~II-132, II-143, II-147, II-149, II-153, II-158, II-160, II-169, II-177, II-182, II-183, II-189, II-195, II-196, II-201, II-207, II-213, II-215, II-217, II-382, II-383, II-387, II-389~II-391, VII-3, VII-4, VII-6, VII-7

〔試験例 10〕ナミハダニに対する殺ダニ効力試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径 3.0 cm の円形に切り取り、径 7 cm のスチロールカップ上の湿った濾紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を 1 葉当たり 10 頭接種した。明細書に記載された本発明化合物の 5%乳剤（化合物によっては 25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm 濃度の薬液に調整しこの薬液をスチロールカップ当たり 2 ml ずつ回転式散布塔を用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、96 時間経過後の死虫率を試験例 7 と同様の計算式から求めた。尚、試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-64, I-95, I-105, I-109, I-111, I-113, I-115, I-117, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I-

-137, I-139, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-289, I-290, I-294, II-91, II-106, II-111, II-114, II-120, II-121, II-123, II-125, II-128, II-131, II-132, II-143, II-144, II-147~II-150, II-153, II-155, II-157, II-158, II-160, II-174, II-175, II-180, II-183, II-189, II-191, II-195, II-196, II-202, II-206, I-210, II-213, II-217, II-382, II-383, II-387, II-389~II-391, VII-3, VII-4, VII-6, VII-7

〔試験例 1 1〕 ハスモンヨトウに対する殺虫効力試験

本発明化合物の 10%乳剤（化合物によっては 25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約 10 秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) の 2 齢幼虫をシャーレ当たり 10 頭放虫し、孔の開いた蓋をして 25℃恒温室に収容した。6 日後の死虫数を試験例 7 と同様の計算式から求めた。尚、試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70%の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-270, I-275, I-276, II-113, II-130, II-131, II-149, II-177, II-183, II-189, II-207, II-213, II-215, II-217, II-382, II-383, II-389, II-391

〔試験例 1 2〕 モモアカアブラムシに対する殺虫効力試験

内径 3 cm のガラスシャーレに湿った濾紙を敷き、その上に同径のキャベツの葉を置いた。モモアカアブラムシ無翅雌成虫を 4 頭放ち、1 日後に回転式散布塔にて薬液を散布 (2.5 mg/cm²) した。薬液は、明細書に記載された本発明化合物の 5%乳剤（化合物によっては 25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して 500 ppm 濃度に調整したものを用いた。処理 6 日後に成虫および幼虫の死虫率を試験例 7 と同様の計算式から求めた。なお試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70%の死虫率を示した。

本発明化合物 No. ; I-16, I-88, I-96, I-223, I-253, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-273, I-275, I-276, I-293, II-1, II-2, II-4, II-7, II-8, II-10, II-11, II-16, II-18, II-21, II-41, II-42, II-46~II-48, II-55, II-57, II-65, II-67, II-69, II-70, II-72, II-73, II-75, II-79, II-81~II-84, II-89~II-92, II-94, II-96, II-98, II-100, II-101, II-106, II-114, II-123, II-125, II-129~II-132, II-137, II-139, II-1

40, II-147, II-149, II-155, II-157, II-158, I-160, II-169, II-171, II-172, II-174, II-175, II-177, II-179, II-181, II-184, II-186, II-189, II-191, II-193, II-195, II-196, II-198, II-199, II-201, II-203~II-209, II-213, II-215, II-216, II-218, II-463VII-3, VII-4, VII-6

〔試験例〕 本発明に係る化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

〔試験例 1〕 イネいもち病防除効果試験（水面施用）

1 / 2 万アールのピーカーポットに植えた 1. 5 葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈し 5 0 0 p p m に調製した薬液を 1 ポット当たり 1 0 m l 灌注処理した。

灌注処理 7 日後、処理したイネに、いもち病菌（*Pyricularia oryzae*）の孢子懸濁液（ 2×10^6 個 / m l）を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度 2 0 ~ 2 5 °C、湿度 9 5 % 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 7 0 以上を示した。

本発明化合物 N o . : I-1, I-2, I-3, I-4, I-7, I-13, I-17, I-20, I-21, I-33, I-37, I-41, I-43, I-44, I-45, I-47, I-50, I-51, I-52, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-64, I-66, I-68, I-70, I-71, I-72, I-73, I-75, I-80, I-82, I-99, I-111, I-128, I-131, I-134, I-143, I-144, I-146, I-151, I-160, I-162, I-164, I-166, I-167, I-168, I-169, I-175, I-176, I-181, I-196, I-197, I-198, I-203, I-204, I-205, I-244, I-246, I-292, II-5, II-6, II-8, II-9, II-32, II-36, II-37, II-123, II-129, II-136, II-463, II-480, II-502, III-4, III-10, III-11, III-12, III-19, III-33, III-36, IV-55, IV-65, IV-67, IV-69, IV-74, IV-75, IV-76, IV-77, IV-78, IV-79, VII-27, VII-30, VIII-1, VIII-2 IX-2, IX-3, IX-5, X-3, XII-18

〔試験例 2〕 イネいもち病防除効果試験（散布試験）

直径 7 c m のポットで育成した 3 葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 5 0 0 p p m に調製した薬液をスプレーガンを用いポット

当たり 20 ml 散布した。

散布翌日イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の孢子懸濁液 (2×10^5 個/ml) を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度 25℃、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-33, I-36, I-37, I-38, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-74, I-76, I-79, I-80, I-82, I-92, I-93, I-94, I-98, I-99, I-100, I-102, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-119, I-126, I-127, I-128, I-129, I-133, I-134, I-137, I-139, I-140, I-141, I-143, I-144, I-145, I-146, I-149, I-150, I-152, I-155, I-160, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-168, I-169, I-171, I-175, I-176, I-179, I-183, I-186, I-187, I-196, I-197, I-198, I-201, III-1, III-2, III-3, III-4, III-12, III-32, IX-10

〔試験例 3〕 コムギうどんこ病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0 ~ 2.5 葉期のコムギ (品種: 農林 61 号) に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布 1 日後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の孢子を直接接種した。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1, I-3, I-4, I-5, I-6, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-1

6, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-31, I-37, I-41, I-43, I-45, I-49, I-50, I-52, I-56, I-59, I-62, I-66, I-67, I-68, I-70, I-72, I-73, I-76, I-78, I-79, I-80, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-90, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-106, I-111, I-113, I-115, I-120, I-125, I-127, I-129, I-130, I-132, I-135, I-143, I-145, I-146, I-147, I-151, I-155, I-160, I-161, I-164, I-166, I-168, I-169, I-177, I-178, I-188, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-201, I-203, I-205, I-206, I-207, I-208, I-210, I-211, I-212, I-213, I-214, I-215, I-218, I-219, I-220, I-223, I-224, I-225, I-226, I-228, I-229, I-234, I-240, I-242, I-243, I-244, I-248, I-249, I-251, I-252, I-253, I-254, I-257, I-258, I-264, I-265, I-266, I-267, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-276, I-277, I-278, I-279, I-281, I-288, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-298, I-299, I-300, I-301, I-303, I-304, III-1, III-2, III-25, III-26, III-30, III-33, III-35, III-38, IX-1, IX-2, IX-5, IX-7, IX-14, IX-19, IX-20, IX-21, XI-1, XI-3, XI-7, XII-1, XII-2, XII-3, XII-4, XII-5, XII-6, XII-8, XII-7, XII-9, XII-10, XII-11, XII-12, XII-13, XII-14, XII-16, XII-18, XII-22, XII-23, XII-24, XII-29

〔試験例４〕 コムギ赤さび病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0 ～ 2.5 葉期のコムギ（品種：農林 61 号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布 1 日後、コムギ赤さび病菌（*Puccinia recondita*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個/ml）を噴霧し、温度 20 ～ 25℃、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種 10 日後に形成された病斑面積を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-18, I-19, I-20, I-21, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-33, I-35, I-36, I-37, I-38, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-59, I-60, I-62, I-

63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-73, I-74, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-102, I-104, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-123, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-130, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-139, I-143, I-144, I-145, I-146, I-147, I-148, I-149, I-151, I-152, I-153, I-155, I-160, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-170, I-171, I-173, I-174, I-175, I-176, I-177, I-178, I-179, I-180, I-181, I-182, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-196, I-197, I-198, I-199, I-200, I-203, I-205, I-206, I-207, I-208, I-209, I-211, I-212, I-214, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-223, I-224, I-225, I-226, I-227, I-228, I-229, I-230, I-232, I-233, I-234, I-236, I-238, I-239, I-240, I-241, I-242, I-243, I-244, I-245, I-246, I-247, I-248, I-249, I-250, I-251, I-252, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-262, I-263, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-275, I-276, I-278, I-279, I-280, I-281, I-282, I-283, I-284, I-285, I-286, I-287, I-288, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-295, I-296, I-297, I-298, I-299, I-300, I-301, I-302, I-303, I-304, I-305, III-1, III-2, III-4, III-5, III-12, III-16, III-17, III-18, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28, III-29, III-30, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, III-43, IV-6, IV-14, IV-19, IV-20, IV-21, X-10, XI-1, XI-2, XI-3, XI-5, XI-7, XII-1, XII-2, XII-3, XI-4, XII-5, XII-6, XII-7, XII-9, XII-10, XII-11, XII-12, XII-13, XII-14, XII-15, XI-16, XII-18, XII-19, XII-23, XII-24, XII-25, XII-26, XII-29

〔試験例 5〕 コムギふ枯れ病防除試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0 ~ 2.5 葉期のコムギ（品種：アルトリア）に、本発明化合物の乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポットあたり 20 ml 散布処理した。

散布 1 日後、ふ枯れ病菌（*Leptosphaeria nodorum*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個/ml）を噴霧し接種を行った。接種を行ったコムギを温度 18 ~ 20℃、湿度 95% 以上の接種箱に 7 ~ 10 日間入れ発病を促進させ

た。形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-31, I-33, I-34, I-36, I-37, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-52, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-73, I-74, I-75, I-76, I-78, I-79, I-80, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-90, I-91, I-93, I-96, I-97, I-99, I-100, I-102, I-103, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-123, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-130, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-143, I-145, I-146, I-147, I-149, I-150, I-153, I-155, I-160, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-170, I-172, I-174, I-175, I-177, I-179, I-182, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-197, I-198, I-199, I-200, I-201, I-203, I-204, I-205, I-206, I-207, I-208, I-209, I-210, I-211, I-212, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-223, I-224, I-225, I-226, I-228, I-229, I-230, I-231, I-232, I-233, I-234, I-235, I-236, I-239, I-240, I-241, I-242, I-243, I-244, I-245, I-246, I-247, I-248, I-249, I-250, I-251, I-252, I-253, I-254, I-256, I-257, I-258, I-260, I-261, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-275, I-276, I-277, I-278, I-279, I-281, I-282, I-283, I-286, I-287, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-295, I-296, I-299, I-300, I-301, I-302, I-303, I-304, II I-1, III-2, III-3, III-4, III-5, III-12, III-14, III-16, III-19, III-22, III-23, II I-25, III-26, III-28, III-29, III-30, III-32, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, IV-1, IV-5, IV-14, IV-15, IV-19, IV-20, IV-21, X-6, X-7, XI-1, XI-2, XI-3, XI-4, X I-5, XI-7, XII-2, XII-3, XII-4, XII-5, XII-6, XII-7, XII-8, XII-9, XII-10, XII-11, X II-12, XII-13, XII-14, XII-15, XII-16, XII-18, XII-19, XII-29

〔試験例6〕 キュウリべと病防除効果試験

直径7cmのポットで育成した1.5葉期のキュウリ（品種：相模半白）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり20ml散布した。

散布1日後、キュウリべと病菌（*Pseudoperonospora cubensis*）の孢子懸濁液（ 2×10^5 個/ml）を噴霧し、温度20～25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種7日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1, I-3, I-6, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-23, I-25, I-28, I-33, I-37, I-38, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-59, I-62, I-64, I-65, I-66, I-68, I-70, I-71, I-72, I-74, I-76, I-80, I-81, I-87, I-89, I-91, I-92, I-102, I-107, I-109, I-110, I-111, I-113, I-114, I-115, I-117, I-118, I-119, I-120, I-125, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-139, I-140, I-144, I-145, I-147, I-149, I-155, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-171, I-172, I-173, I-175, I-176, I-177, I-178, I-179, I-181, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-208, I-211, I-217, I-218, I-219, I-219, I-220, I-223, I-225, I-228, I-229, I-232, I-236, I-239, I-240, I-241, I-244, I-245, I-247, I-248, I-252, I-253, I-258, I-264, I-268, I-270, I-274, I-275, I-276, I-292, I-293, I-294, I-295, III-2, III-35, III-43, IV-2, IV-18, IV-19, XI-3, XII-2, XII-25

〔試験例7〕 トビイロウンカに対する殺虫試験

本発明化合物の5%乳剤（化合物によって25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液に調製した。

この薬液を1/20, 000アールのポットに植えたイネの茎葉に十分量散布した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの2令幼虫をポット当たり、10頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管した。調査は6日経過後に行い死虫率を下記の計

算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

$$\text{死虫率 (\%)} = [\text{死虫数} / (\text{死虫数} + \text{生存虫数})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-50, I-184, I-270, I-275, I-276, I-277

〔試験例8〕 ツマグロヨコバイに対する殺虫試験

本発明化合物の500ppm濃度の乳化液中に稲の茎葉を約10秒間浸漬し、この茎葉をガラス円筒に入れ、有機リン系殺虫剤に抵抗性を示すツマグロヨコバイ成虫を放ち、孔のあいた蓋をして25℃の恒温室に収容し、6日後の死虫数を調査し、試験例7と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は2区制でおこなった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-10, I-11, I-16, I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-68, I-72, I-83, I-88, I-89, I-91, I-109, I-113, I-137, I-160, I-162, I-166, I-168, I-197, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-275, I-290, I-292, III-5, IV-12

〔試験例9〕 コナガに対する接触性殺虫試験

本発明化合物の500ppm濃度の水乳化液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ2令幼虫をシャーレ当たり10頭ずつ放ち、孔のあいた蓋をして25℃の恒温室に収容し、6日後の死虫数を調査し、試験例7と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は2区制でおこなった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-37, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-63, I-88, I-89, I-96, I-109, I-113, I-119, I-125, I-129, I-137, I-203, I-208, I-220, I-257, I-258, I-270, I-275, I-276, I-277, I-279, I-281

〔試験例10〕 ナミハダニに対する殺ダニ効力試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った濾紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を1葉当たり10頭接種した。明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液に調整しこの薬液をスチロールカップ当たり2mlずつ回転式散布塔を用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、96時間経過後の死虫率を試験例7と

同様の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-64, I-95, I-105, I-109, I-111, I-113, I-115, I-117, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I-137, I-139, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-289, I-290, I-294

〔試験例11〕ハスモンヨトウに対する殺虫効力試験

本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を試験例7と同様の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-270, I-275, I-276

〔試験例12〕モモアカアブラムシに対する殺虫効力試験

内径3cmのガラスシャーレに湿った濾紙を敷き、その上に同径のキャベツの葉を置いた。モモアカアブラムシ無翅雌成虫を4頭放ち、1日後に回転式散布塔にて薬液を散布 (2.5 mg/cm^2) した。薬液は、明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して500ppm濃度に調整したものを用いた。処理6日後に成虫および幼虫の死虫率を試験例7と同様の計算式から求めた。なお試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%の死虫率を示した。

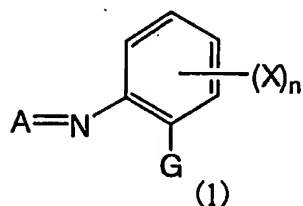
本発明化合物No. ; I-16, I-88, I-96, I-223, I-253, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-273, I-275, I-276, I-293

産業上の利用可能性

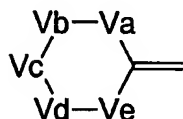
本発明のヘテロ環イミノフェニル化合物は優れた殺菌殺虫活性を有し、作物に対しても安全である。

請求の範囲

1. 式(1) :



〔式中、Aは、



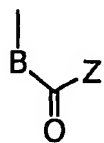
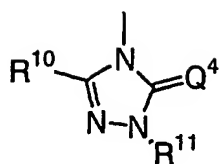
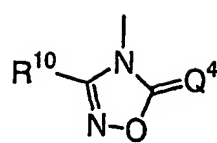
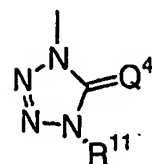
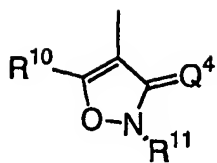
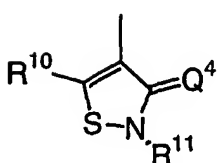
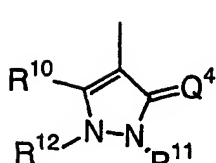
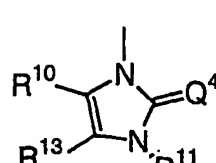
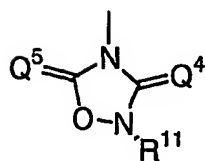
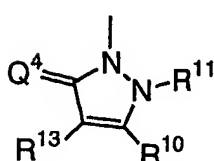
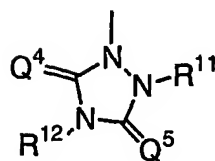
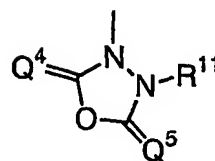
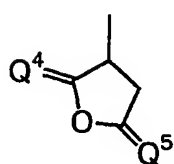
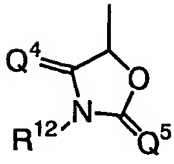
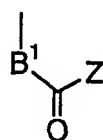
であり、Va、Vb、VcおよびVdはそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、Veは炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合であり（但し、Va、Vb、Vc、VdおよびVeから選ばれる少なくとも1個は、窒素原子、酸素原子または硫黄原子である。）、

Va-Vb、Vb-Vc、Vc-Vd、Vd-Veの結合は、それぞれ単結合でも2重結合でもよく、

それぞれの原子上に水素原子またはYが結合していてもよく、

ただし、Aがキノロン環を表すときはキノロン環内の窒素原子は、イミノ結合のα位にあり、イミノ結合がピリミジン環、チアゾリン環またはチアゾリジン環の2位にあるときは、ピリミジン環の一方の窒素原子、チアゾリン環またはチアゾリジン環の窒素原子は置換基Yで置換されており、

Gは、G'からG''

G¹:G²:G³:G⁴:G⁵:G⁶:G⁷:G⁸:G⁹:G¹⁰:G¹¹:G¹²:G¹³:G¹⁴:G¹⁵:G¹⁶:

から選ばれる基を表し、

Z は、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ または $-\text{NR}'\text{R}''$ であり、

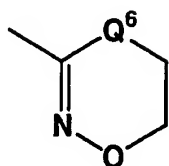
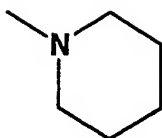
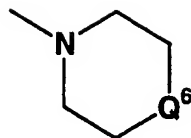
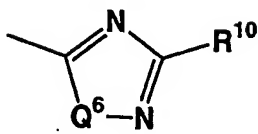
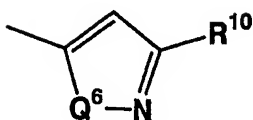
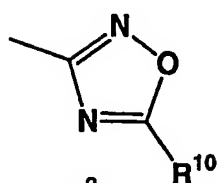
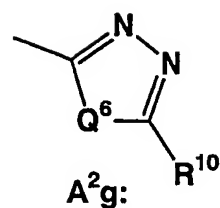
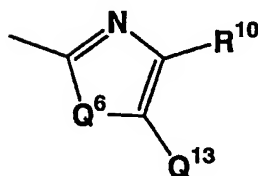
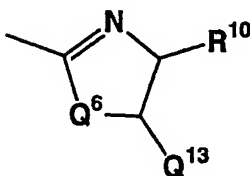
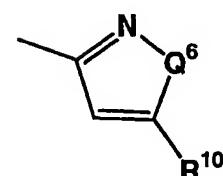
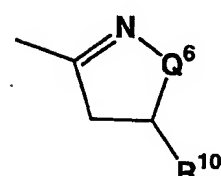
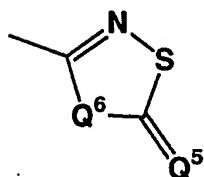
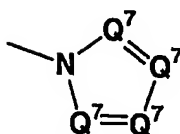
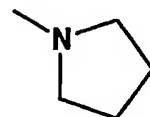
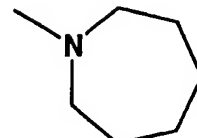
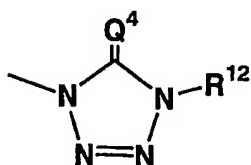
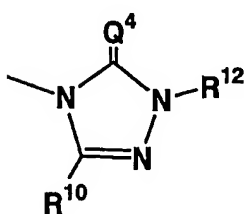
B は、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ または $-\text{C}(=\text{N}-\text{OR}')$ であり、

B' は、 $-\text{N}(\text{OR}')-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{N}(\text{OR}')-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{S}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{OR}')-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{C}(=\text{CH}-\text{OR}')$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{C}$

H-OR') -, -S-C (=CH-OR') -, -N (OR') -C (=N-OR'
) -, -N (R') -C (=N-OR') -, -O-C (=N-OR') -または-
 S-C (=N-OR') -であり、

B'は、-CH₂-, -CH (CN) -, -CH (C≡CH) -, -C (=CH
 -OR') -, -C (=N-OR') -, -CH (OR') -, -N (OR') -, -
 N (R') -, -O-, -S-, -N (OR') -CH₂-, -N (R') -CH₂-
 、-O-CH₂-または-S-CH₂-, であり、

A'は、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいピリ
 ジルまたはA'a から A'q

A²a:A²b:A²c:A²d:A²e:A²f:A²g:A²h:A²i:A²j:A²k:A²l:A²m:A²n:A²o:A²p:A²q:

から選ばれる基を表し、

Yは、Y' - D - (CH₂)_n - であるか（ただし、Yが2個以上の時は、同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいて

もよい3～7員環または $C=Q^1$ を形成するか、あるいは V_a と V_b 、 V_b と V_c 、 V_c と V_d または V_d と V_e 上の2個の置換基 Y どうしが一緒になって、 V_a と V_b 、 V_b と V_c 、 V_c と V_d または V_d と V_e とともに炭素原子、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった1種以上の原子を含み、 Y で置換されていてもよい5または6員環を形成しており、

D は、単結合、 $-NR^5-$ 、 $-C(=Q^1)-$ 、 $-C(=Q^1)-C(=Q^1)-$ 、 $-CR^6=N-$ 、 $-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-N=CR^6-$ 、 $-N=CR^6-O-N=CR^6-$ 、 $-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-O-CR^6=N-O-$ 、 $-O-N=CR^6-CR^6=N-O-$ 、 $-CR^6=N-NR^5-$ または $-O-N=CR^6-CR^6=N-NR^5-$ であり、

Q^1 、 Q^1 および Q^1 は、各々独立に、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N-R^7$ または $=C(R^8)$ (R^8) であり、

Q^4 および Q^4 は、各々独立に $=O$ または $=S$ であり、

Q^6 は、 $-S-$ または $-O-$ であり、

Q^7 は、各々独立に、 $=N-$ または $=CH-$ であり、

X は、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ、 $(C_1\sim C_6$ アルキル) $_2$ アミノ、 NO_2 、 CN 、ホルミル、 OH 、 SH 、 NU^1U^1 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 R^4 で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたは $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシであり（ただし、置換する X が、2個以上の場合同一か相互に異なってもよい。）

R^1 、 R^2 および R^4 は、各々独立に、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^4 で置換されていてもよいフェニル $C_1\sim C_6$ アルキルまたは R^4 で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1\sim C_6$ アルキルであり、

R^3 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフェニル C_1

～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルであり、

R⁵およびR⁶は、各々独立に、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₂～C₆アルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルケニルオキシ、C₂～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₂～C₆アルケニルスルフィニル、C₂～C₆アルケニルスルホニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₂～C₆ハロアルケニルスルホニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキニルオキシ、C₂～C₆ハロアルキニルオキシ、C₂～C₆アルキニルスルフェニル、C₂～C₆アルキニルスルフィニル、C₂～C₆アルキニルスルホニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルフィニル、C₂～C₆ハロアルキニルスルホニル、NO₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは-NU'U'であり、

但し、R⁶は水素原子であってもよく、

R⁷は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロア

ルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリール、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたは R^* で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルであり、

R^* および R^* は、各々独立に、水素原子、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 NO_2 、 CN 、ホルミルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^{10} は、水素原子、ハロゲン、 R^{11} 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SOR^{11}$ 、または $-SO_2R^{11}$ であり、

R^{11} は、水素原子、 R^{12} または CN であり、

R^{12} は、水素原子または R^{13} であり、

R^{13} は、水素原子、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキニルであり、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

Y' は、ハロゲン、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルキル、R'で置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルキル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルケニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルキニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₂アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロア

リール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 NO_2 、 CN 、ホルミルまたはナフチルであり、

R' は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフェニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルホニル、 NO_2 、 CN 、ホルミル、 SH 、 OH 、 SCN 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、フェニルまたは— $NU'U'$ であって、置換する R' の数は 1 ないし 5 個であり（ただし、 R' が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

R'' は、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アル

コキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルスルホニル、 NO_2 、 CN 、ホルミル、 OH 、 SH 、 SCN 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 R^* で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリール、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、 R^* で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R^* で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R^* で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたは R^* で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $-NU^1U^2$ であるか、あるいは、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であって、置換する R^* の数は 1 ないし 8 個であり（ただし、 R^* が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

R^* は、ハロゲン、 R^* で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^* で置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^* で置換されていてもよい $C_1 \sim C_{12}$ ア

ルケニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₁アルキニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₁₁アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルオキシ、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルケニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキニルスルホニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルコキシカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいC₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、NO₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁~C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフェニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁~C₆アルキルスルフィニル、R'で置換されていて

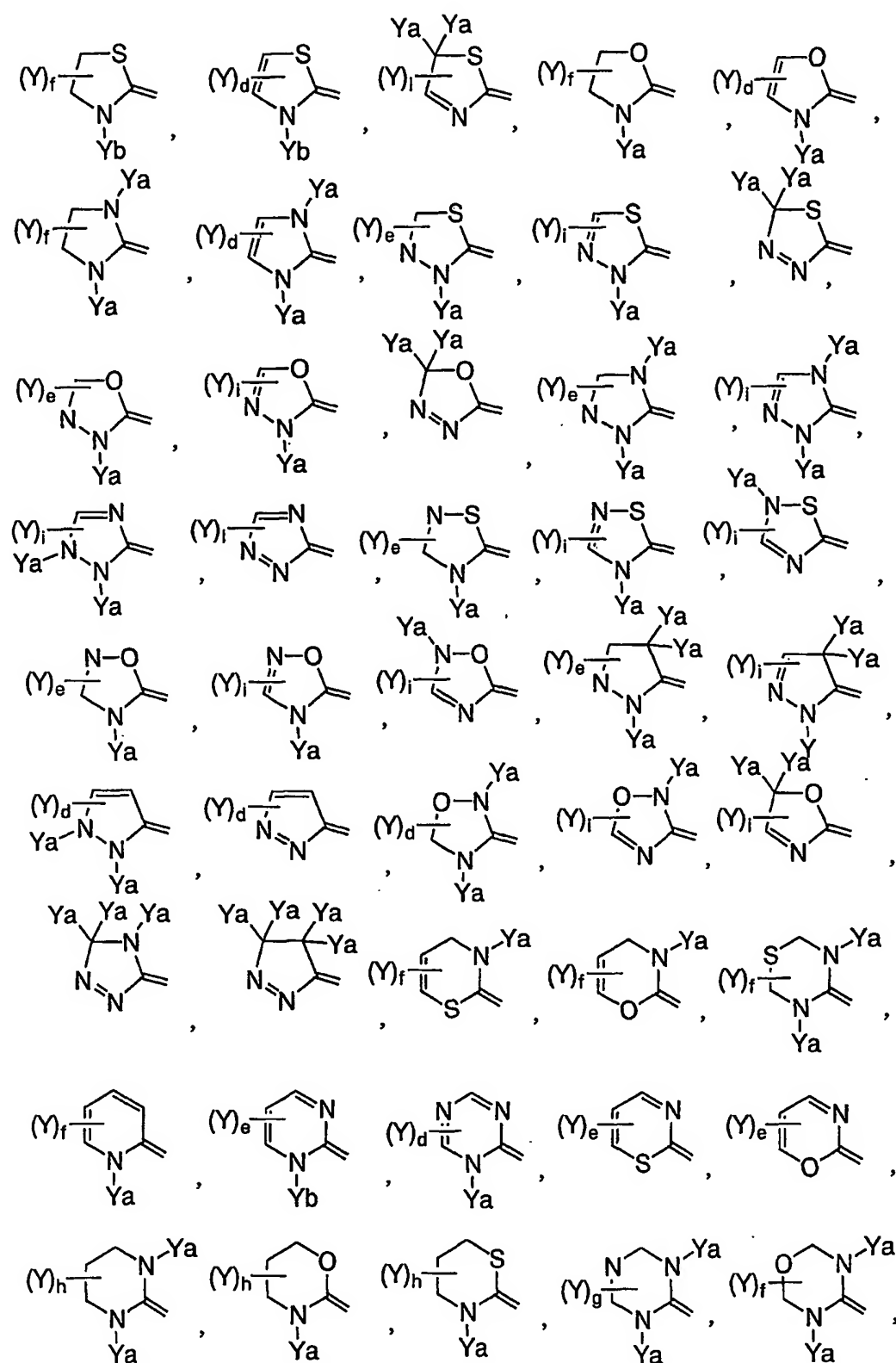
もよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、 R' で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシまたは $-N^+U^+U'$ であり、置換する R' の数は 1 ないし 5 個であり（ただし、 R' が 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

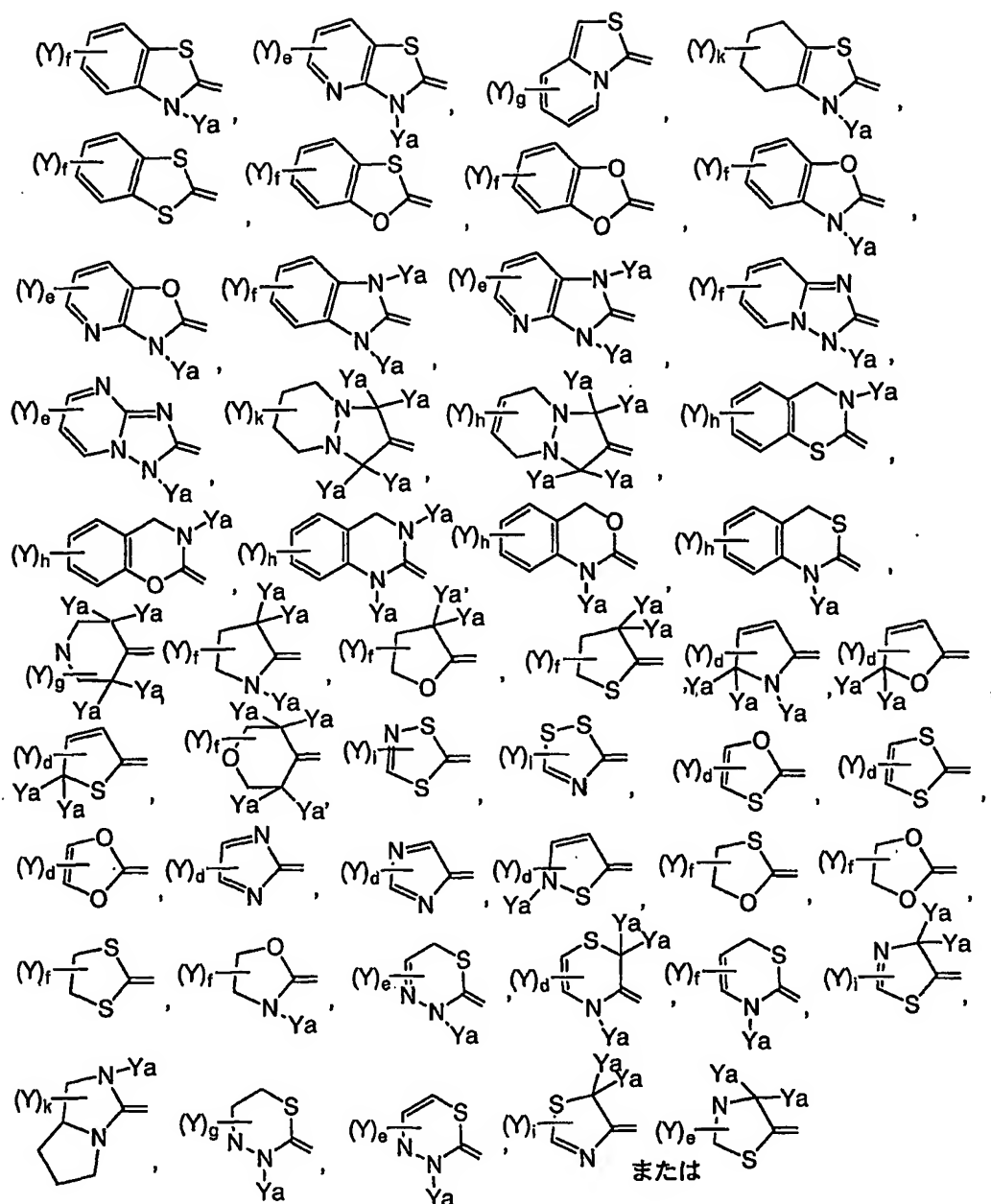
U' および U'' は、各々独立に、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルであるか、あるいは U' および U'' が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた 1 から 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 から 7 員環であり、

n は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

p は、繰り返しの数を表し、0 から 2 である。〕で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

2. A が





であり、d は、置換基の数を表し、0 から 2 であり、

e は、置換基の数を表し、0 から 3 であり、

f は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

g は、置換基の数を表し、0 から 5 であり、

h は、置換基の数を表し、0 から 6 であり、

i は、置換基の数を表し、0 から 1 であり、

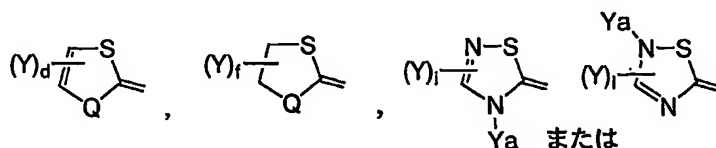
j は、置換基の数を表し、0 から 7 であり、

k は、置換基の数を表し、0 から 8 であり、

Y a、Y b および Y は、互いに独立に Y' - D - (CH₂)_p であるか（ただし、Y または Y a が 2 個以上の時は、Y a どうしまたは Y どうしは互いに同一または異なってもよい。）、A の同一炭素原子上に置換した 2 個の Y または Y a により、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々 1 ～ 3 個含んでいてもよい 3 ～ 7 員環または C = Q' を形成し、

Y は更に水素原子を表していてもよい、請求項 1 記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

3. A が



を表し、Q は酸素原子、硫黄原子または N - Y b を表し、Y、Y a、Y b、d、f および i は請求項 2 と同じ意味を表す、請求項 1 または請求項 2 記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

4. D が単結合であり、p が 0 である請求項 1 から請求項 3 のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

5. Y' がハロゲン、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルコキシ、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルフェニル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルフィニル、R^b で置換されていてもよい C₁ ～ C₁₂ アルキルスルホニル、R^b で置換されていてもよいフェニルまたは R^b で置換されていてもよいヘテロアリールである、請求項 1 から請求項 4 のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

6. G が G¹、G²、G³ または - B' - A' a である請求項 1 から請求項 5 のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

7. Gが $-N(OR')-C(=O)Z$ または $-N(R')-C(=O)Z$ である請求項1から請求項5のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

8. Y'が少なくともひとつのR'で置換されたフェニルまたは少なくともひとつのR'で置換されたヘテロアリールであり、R'のうち少なくともひとつがトリフルオロメチルであり、ただし、GがG'のときはnが1以上である、請求項1から請求項7のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

9. 農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシュウ酸塩である、請求項1から請求項8のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物の塩。

10. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

11. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

12. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺虫剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06424

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 82, 279/06, 285/16, 12, 339/06, 327/04, 411/04, 10, 14, 413/04, 417/04, 10, 12, A01N43/28, 30, 40, 50, 52, 54, 56, 64, 653, 76, 78, 82, 824, 836, 86, 88, 90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D, A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| X | US 5238903 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 24 August, 1993 (24.08.93), Full text; particularly, compounds on columns 15 to 36 & JP 3-244593 A | 1, 2, 4-7 |
| X | US 5021394 A (DAI NIPPON PRINTING CO., LTD.), 04 June, 1991 (04.06.91), Particularly, compounds 14, 18 on columns 5 to 6 & JP 3-16792 A | 1, 2, 4-7 |
| X | EP 287377 A2 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 19 October, 1988 (19.10.88), Particularly, compound 64 on page 27 & JP 1-165565 A & US 5028708 A & US 5061796 A & US 5136054 A & US 5220027 A | 1, 2, 4-7 |

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
25 July, 2002 (25.07.02)

Date of mailing of the international search report
06 August, 2002 (06.08.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06424

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| X | JP 5-177959 A2 (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 20 July, 1993 (20.07.93), Particularly, compound 23 on page 23; compound 35 on page 26; pigment e on page 48 (Family: none) | 1-8 |
| X | JP 5-70704 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 23 March, 1993 (23.03.93), Particularly, compound 3-6 on page 12; compounds 15, 16 on page 14; compounds 19, 20, 23 on page 15; compound 26 on page 16; compound 48 on page 20; compounds 53, 54 on page 22 (Family: none) | 1-8 |
| X | JP 5-202305 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 10 August, 1993 (10.08.93), Particularly, compound 17 on page 17 (Family: none) | 1, 2, 4-8 |
| X | KALCHEVA, V., et al., Ring transformations of oxazoles and their derivatives. Synthesis of 2, 3-dihydro-2-[(2-hydroxyphenyl)imino]-4- methylthiazoles by reaction of 2-[(2-oxopropyl)thio] benzoxazoles with amines. Liebigs Ann. Chem., 1993, No.12, pages 1319 to 1322; refer to 2'- phenylcarbamoyloxy derivative 4d on page 1322 | 1-7 |
| X | GB 2226562 A1 (BOOTS CO. PLC), 04 July, 1990 (04.07.90), Particularly, 4-[2-(1, 3, 3-trimethyl-2- pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine on page 17; 4-[2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)- benzyl] morpholine on page 24; 4-[4-chloro-2-(1, 3-dimethyl-2- pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine on page 24 & EP 385038 A1 & US 5223498 A & JP 02229148 A & US 5373008 A | 1, 2, 4, 5 |
| P, X | WO 01/47888 A1 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES), 05 July, 2001 (05.07.01), Full text (Family: none) | 1-12 |

<Concerning the subject of search>

In the general formula set forth in claim 1, most of the constituent moieties are represented in terms of replaceable groups, and the general formula therefore includes extremely many compounds. However, only a special part of the claimed compounds are supported by the description within the meaning of PCT Article 6 and disclosed within the meaning of PCT Article 5.

Accordingly, this prior art search has been made only on the disclosed compounds, i.e., compounds represented by the general formula wherein A is a group described in claim 2, Y' does not form any additional fused ring, and G is G1, G2, G15, or G16, with the proviso that when G is G16, B2 is -CH2- and A2 is a heterocycle.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ¹ C07D213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 82, 279/06, 285/16, 12, 339/06, 327/04, 411/04, 10, 14, 413/04, 417/04, 10, 12, A01N43/28, 30, 40, 50, 52, 54, 56, 64, 653, 76, 78, 82, 824, 836, 86, 88, 90

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ¹ C07D, A01N

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| X | US 5238903 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993.08.24 全文献、特に、第15欄～36欄の化合物などを参照。 & JP 3-244593 A | 1, 2, 4-7 |
| X | US 5021394 A (DAI NIPPON PRINTING CO., LTD.) 1991.06.04 特に、第5-6欄の化合物No. 14, 18などを参照。 & JP 3-16792 A | 1, 2, 4-7 |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に関する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

25.07.02

国際調査報告の発送日

06.08.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

齋藤 恵

4 P

9164

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|---|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | EP 287377 A2 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.) 1988. 10. 19 特に、第27頁の化合物No. 64などを参照。 & JP 1-165565 A & US 5028708 A & US 5061796 A & US 5136054 A & US 5220027 A | 1, 2, 4-7 |
| X | JP 5-177959 A2 (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993. 07. 20 特に、第23頁の化合物23、第26頁の化合物35、第48の色素eなどを 参照。 (ファミリーなし) | 1-8 |
| X | JP 5-70704 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993. 03. 23 特に、第12頁の化合物3-6、第14頁の化合物15, 16、第15頁の化合物 19, 20, 23、第16頁の化合物26、第20頁の化合物48、第22頁の化合物 53, 54などを参照。 (ファミリーなし) | 1-8 |
| X | JP 5-202305 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993. 08. 10 特に、第17頁の化合物17などを参照。 (ファミリーなし) | 1, 2, 4-8 |
| X | KALCHEVA, V., et. al. Ring transformations of oxazoles and their derivatives. Synt hesis of 2, 3-dihydro-2-[(2-hydroxyphenyl)imino]-4- methylthiazoles by reaction of 2-[(2-oxopropyl)thio] benzoxazoles with amines. Liebigs Ann. Chem., 1993, No. 12, p. 1319-1322. p. 1322に記載された4dの2'-phenylcarbamoxy誘導体を参照。 | 1-7 |
| X | GB 2226562 A1 (BOOTS, CO. PLC) 1990. 07. 04 特に、第17頁に記載の 4-[2-(1, 3, 3-trimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine、 第24頁に記載の 4-[2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine、 4-[4-chloro-2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)- benzyl]morpholine などを参照。 & EP 385038 A1 & US 5223498 A & JP 02229148 A & US 5373008 A | 1, 2, 4, 5 |
| PX | WO 01/47888 A1 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES) 2001. 07. 05 全文を参照。 (ファミリーなし) | 1-12 |

<調査の対象について>

請求の範囲1に記載された化合物の一般式は、大部分が可変の基で表現され、非常に多数の化合物を含むものである。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、請求の範囲に記載された化合物の特定の部分に限られている。

したがって、先行技術文献調査は、開示されている部分、すなわち、請求の範囲に記載の一般式における基Aが請求の範囲2に記載されているものであって、Y' がさらなる縮合環を形成せず、かつ、基GがG1、G2、G15、又はG16であって、GがG16である場合には、B2は-CH₂-であり、かつ、A2が複素環であるものに限定して行った。